

This Page Is Inserted by IFW Operations  
and is not a part of the Official Record

## **BEST AVAILABLE IMAGES**

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images may include (but are not limited to):

- BLACK BORDERS
- TEXT CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES
- FADED TEXT
- ILLEGIBLE TEXT
- SKEWED/SLANTED IMAGES
- COLORED PHOTOS
- BLACK OR VERY BLACK AND WHITE DARK PHOTOS
- GRAY SCALE DOCUMENTS

**IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.**

**As rescanning documents *will not* correct images,  
please do not report the images to the  
Image Problem Mailbox.**

PCT

世界知的所有権機関

国際事務局

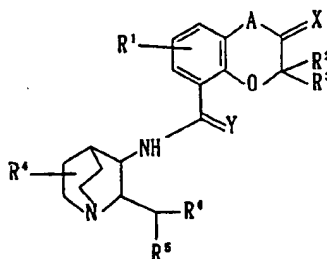


## 特許協力条約に基づいて公開された国際出願

|  |  |   |
|--|--|---|
| (51) 国際特許分類 5<br>C07D 453/02, A61K 31/435<br>A61K 31/44, 31/535  | A1   | (11) 国際公開番号<br>WO 93/09116<br>(43) 国際公開日<br>1993年5月13日 (13.05.1993) |
| (21) 国際出願番号 PCT/JP92/01426<br>(22) 国際出願日 1992年11月4日 (04. 11. 92)<br>(30) 優先権データ<br>特願平3/319794 1991年11月7日 (07. 11. 91) JP<br>(71) 出願人 (米国を除くすべての指定国について)<br>吉富製薬株式会社<br>(YOSHITOMI PHARMACEUTICAL INDUSTRIES, LTD.)<br>[JP/JP]<br>〒541 大阪府大阪市中央区平野町二丁目6番9号 Osaka, (JP)<br>(72) 発明者; および<br>(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ)<br>村上 修 (MURAKAMI, Shu) [JP/JP]<br>北嶋 浩 (KITAJIMA, Hiroshi) [JP/JP]<br>鹿子嶋正彦 (KAGOSHIMA, Masahiko) [JP/JP]<br>安松 浩 (YASUMATSU, Hiroshi) [JP/JP]<br>〒871 福岡県築上郡吉富町大字小沢955番地<br>吉富製薬株式会社 中央研究所内 Fukuoka, (JP)<br>(74) 代理人<br>弁理士 高島 一 (TAKASHIMA, Hajime)<br>〒541 大阪府大阪市中央区平野町三丁目3番9号 湯木ビル<br>Osaka, (JP) | (81) 指定国<br>AT (欧州特許), BE (欧州特許), CA, CH (欧州特許),<br>DE (欧州特許), DK (欧州特許), ES (欧州特許), FR (欧州特許),<br>GB (欧州特許), GR (欧州特許), HU, IE (欧州特許),<br>IT (欧州特許), JP, KR, LU (欧州特許), MC (欧州特許),<br>NL (欧州特許), SE (欧州特許), US.<br>添付公開書類<br>国際調査報告書<br>補正書 |   |

(54) Title : QUINUCLIDINE COMPOUND AND MEDICINAL USE THEREOF

(54) 発明の名称 キヌクリジン化合物およびその医薬用途



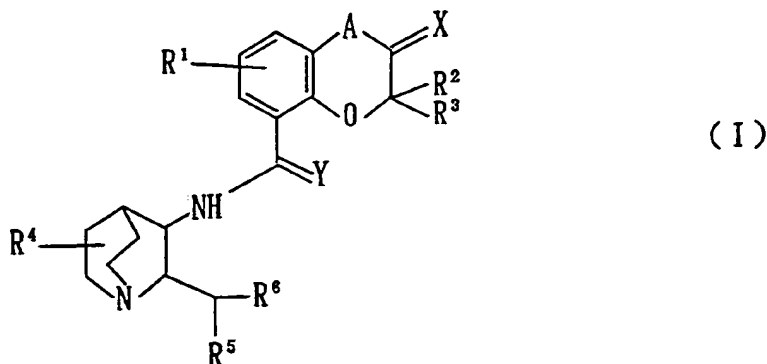
(1)

## (57) Abstract

A quinuclidine compound represented by general formula (I) and a pharmaceutically acceptable acid addition salt thereof, wherein each symbol is as defined in the specification. Because they have a P substance antagonism, they are useful for treating pains such as migraine, inflammations, respiratory system diseases such as chronic bronchitis accompanied with cough, sputum, etc., asthma, or rhinitis, central nervous system diseases such as anxiety or psychosis, cardiovascular system diseases such as hypertension or heart failure, and digestive system diseases such as hypersensitive colitis, ulcerous colitis or Crohn disease.

(57) 要約

一般式 (I)



(式中、各記号は明細書に定義されている通りである。)

により表されるキヌクリジン化合物またはその医薬上許容されうる酸付加塩。

本発明のキヌクリジン化合物またはその医薬上許容されうる酸付加塩は、P物質の拮抗作用を有することから、痛み（片頭痛など）、炎症、呼吸器系疾患（咳、喀痰などを伴う慢性気管支炎、喘息、鼻炎など）、中枢神経系疾患（不安症、精神病など）、循環器系疾患（高血圧症、心不全など）、消化器系疾患（過敏性大腸炎、潰瘍性大腸炎、クローン病など）の治療薬として有用である。

情報としての用途のみ

PCTに基づいて公開される国際出願のパンフレット第1頁にPCT加盟国を同定するために使用されるコード

AT オーストリア  
AU オーストラリア  
BB バルバドス  
BE ベルギー  
BF ブルキナ・ファソ  
BG ブルガリア  
BJ ベナン  
BR ブラジル  
CA カナダ  
CF 中央アフリカ共和国  
CG コンゴ  
CH スイス  
CI コート・ジボアール  
CM カメルーン  
CS チェッコスロヴァキア  
CZ チェッコ共和国  
DE ドイツ  
DK デンマーク  
FI フィンランド  
ES スペイン

FR フランス  
GA ガボン  
GB イギリス  
GN ギニア  
GR ギリシャ  
HU ハンガリー  
IE アイルランド  
IT イタリア  
JP 日本  
KP 朝鮮民主主義人民共和国  
KR 大韓民国  
KZ カザフスタン  
LI リヒテンシュタイン  
LK スリランカ  
LU ルクセンブルグ  
MC モナコ  
MG マダガスカル  
ML マリ  
MN モンゴル  
MR モーリタニア

MW マラウイ  
NL オランダ  
NO ノルウェー  
NZ ニュージーランド  
PL ポーランド  
PT ポルトガル  
RO ルーマニア  
RU ロシア連邦  
SD スーダン  
SE スウェーデン  
SK スロヴァキア共和国  
SN セネガル  
SU ソヴィエト連邦  
TD チャド  
TG トーゴ  
UA ウクライナ  
US 米国  
VN ヴェトナム

## 明細書

## キヌクリジン化合物およびその医薬用途

## 「技術分野」

本発明は、ペプチド性神経伝達物質であるP物質（Substance P: Arg-Pro-Lys-Pro-Gln-Gln-Phe-Phe-Gly-Leu-Met-NH<sub>2</sub>）の拮抗作用を有することを特徴とする、痛み、炎症、呼吸器系疾患、中枢神経系疾患、消化器系疾患、循環器系疾患の治療薬として有用なキヌクリジン化合物またはその医薬上許容されうる酸付加塩およびその医薬用途に関するものである。

## 「背景技術」

P物質、ニューロキニンA、ニューロキニンBなどのニューロキニンと称される物質は哺乳動物において見出されるタヒキニン系ペプチドであり、とりわけP物質が痛みの伝達や、不安を惹起すること、さらには精神分裂症、呼吸器系疾患、炎症および消化器系疾患などの種々の病理学的分野に関与することはよく知られている（たとえば、ジャーナル・オブ・メディシナル・ケミストリー（Journal of Medicinal Chemistry）Vol. 25, P.1009）。したがって、P物質に特異的な拮抗作用を有する物質は前述の疾患を治療するのに有用と考えられる。

これまでに、ペプチド性P物質拮抗剤としては、米国特許第4, 559, 324号（特開昭59-21656号）、ヨーロッパ公開特許第360390号（特開平2-124887号）、ヨーロッパ公開特許第336230号（特開平2-204499号）、ヨーロッパ公開特許第394989号（特開平3-27399号）などに開示されているが、経口投与での有効性は必ずしも明確ではなく、また生体内でも速やかに分解されるなどの問題点が残る。一方、非ペプチド性拮抗薬としてはWO90/05729号、米国特許第5, 102, 667号（特開平3-176469号）、ヨーロッパ公開特許第428434号（特開平3-206086号）などに開示されているが、作用の持続や安全性などの点で必ずしも満足できるものとはいえない。

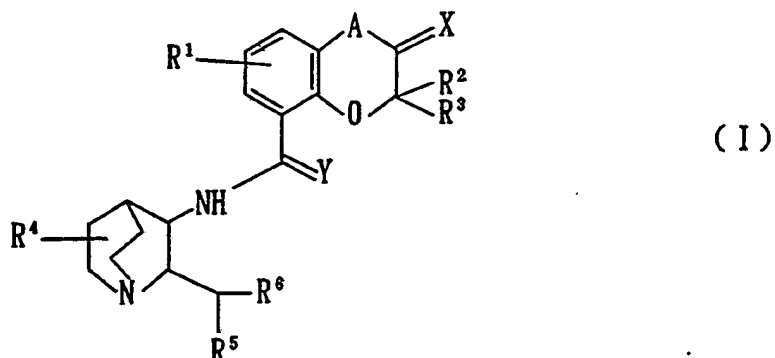
ところで、特開昭59-186969号、特開平1-168686号の各公報により、鎮吐作用などを有するベンゾフランおよびベンゾピラン化合物が知られ

ている。また、ヨーロッパ公開特許第407137号（特開平3-279372号）、米国特許第4,892,872号（特開平2-28182号）などの公報により5-HT<sub>2</sub>拮抗作用を有し、制吐剤などとして有用なベンズオキサジン化合物が知られている。

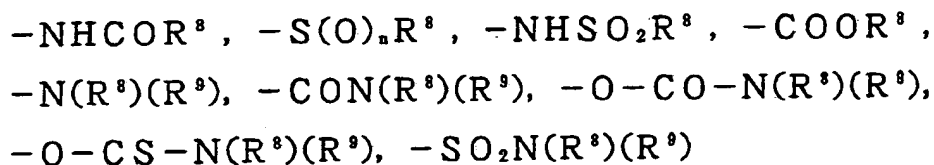
### 「発明の開示」

本発明者らは、かかる問題点を解決すべく鋭意研究を行った結果、新規キヌクリジン化合物がタヒキニン類、とりわけP物質の拮抗作用を有し、さらにバイオアベイラビリティーの面で改良されていることを見出し、本発明を完成させるに至った。

すなわち、本発明は、一般式（I）



〔式中、Aはメチレン基、酸素原子、硫黄原子、 $-N(R^7)-$ で表される基（式中、 $R^7$ は水素、炭素数1～6個のアルキルまたはアラルキルを示す。）または直接結合を示す。XおよびYは同一または異なって酸素原子、硫黄原子または水素2原子を示す。 $R^1$ は水素、ハロゲン、炭素数1～6個のアルキル、ハロアルキル、アラルキル、炭素数1～6個のアルコキシ、アラルキルオキシ、アリールオキシ、アシル、アシルオキシ、ヒドロキシ、アミノ、ニトロ、シアノまたは式



（式中、 $R^8$ 、 $R^9$ は同一または異なってそれぞれ水素、炭素数1～6個のアルキル、フェニルまたはアラルキルを示し、nは0、1または2を示す。）

から選ばれる基を示す。 $R^2$ 、 $R^3$ は同一または異なって水素または炭素数1～6個のアルキルを示す。 $R^4$ は水素または炭素数1～6個のアルキルを示す。 $R^5$ はチエニルまたはフェニルを示す。 $R^6$ は炭素数1～6個のアルキル、炭素数2～6個のアルケニル、炭素数3～7個のシクロアルキル、フリル、チエニル、ピリジル、インドリル、ビフェニルまたはフェニルを示す。ただし、Aが酸素原子、XおよびYが共に水素2原子、 $R^1$ が水素かつ $R^2$ 、 $R^3$ が共に水素である場合、およびAが直接結合、XおよびYが共に水素2原子、 $R^1$ が水素かつ $R^2$ 、 $R^3$ が共に水素である場合を除く。]

により表されるキヌクリジン化合物またはその医薬上許容されうる酸付加塩に関する。

上記定義中および本明細書において、ハロゲンとは塩素、フッ素、臭素、ヨウ素を示す。

炭素数1～6個のアルキルとは、直鎖状または分枝鎖状のアルキルを示し、たとえばメチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、イソブチル、第3級ブチル、ペンチル、イソペンチル、ヘキシルなどが挙げられる。

ハロアルキルとは、アルキル部が炭素数1～6個であって、たとえばクロロメチル、フルオロメチル、トリフルオロメチル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、トリクロロメチルなどが挙げられる。

炭素数1～6個のアルコキシとは、直鎖状または分枝鎖状のアルコキシを示し、たとえばメトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、ブトキシ、イソブトキシ、第3級ブトキシ、ペンチルオキシ、イソペンチルオキシ、ヘキシルオキシなどが挙げられる。

アラルキルとは、アルキル部が炭素数1～4個であるフェニルアルキルであって、ベンジル、2-フェニルエチル、1-フェニルエチル、3-フェニルプロピル、4-フェニルブチルなどが挙げられ、フェニル環上にハロゲン、ニトロ、アミノ、水酸基、トリフルオロメチル、炭素数1～6個のアルキル、炭素数1～6個のアルコキシから選ばれる1～3個の置換基を有していてもよい。

アラルキルオキシとは、アルキル部が炭素数1～4個であるフェニルアルキル

オキシであって、たとえばベンジルオキシ、2-フェニルエトキシ、3-フェニルプロポキシ、4-フェニルブトキシなどが挙げられ、フェニル環上にハロゲン、ニトロ、アミノ、水酸基、トリフルオロメチル、炭素数1~6個のアルキル、炭素数1~6個のアルコキシから選ばれる1~3個の置換基を有していてもよい。

アリールオキシとは、アリール部が複素芳香環でもよく、たとえばフェノキシ、ピリジルオキシ、フリルオキシ、チエニルオキシなどが挙げられ、アリール部にハロゲン、ニトロ、アミノ、水酸基、トリフルオロメチル、炭素数1~6個のアルキル、炭素数1~6個のアルコキシから選ばれる1~3個の置換基を有していてもよい。

アシルとは、アセチル、プロピオニル、ブチリル、イソブチリル、ピバロイルなどの炭素数2~5個のアルカノイルまたはベンゾイルなどが挙げられ、ベンゾイルのフェニル環上にハロゲン、ニトロ、アミノ、水酸基、トリフルオロメチル、炭素数1~6個のアルキル、炭素数1~6個のアルコキシから選ばれる1~3個の置換基を有していてもよい。

アシルオキシとは、アシル部が前記した炭素数2~5個のアルカノイルまたはベンゾイルであって、アセチルオキシ、プロピオニルオキシ、ブチリルオキシ、イソブチリルオキシ、ピバロイルオキシ、ベンゾイルオキシなどが挙げられ、ベンゾイルのフェニル環上にハロゲン、ニトロ、アミノ、水酸基、トリフルオロメチル、炭素数1~6個のアルキル、炭素数1~6個のアルコキシから選ばれる1~3個の置換基を有していてもよい。

炭素数2~6個のアルケニルとは、たとえばビニル、アリル、1-プロペニル、1-ブテニル、2-ブテニル、1-ペンテニル、2-ペンテニル、1-ヘキセニルなどが挙げられる。

炭素数3~7個のシクロアルキルとは、たとえばシクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチルが挙げられ、炭素数1~4個のアルキルにより置換されていてもよい。

前記フェニル、チエニル、フリル、ピリジル、インドリル、ビフェニルにあっては、その環上にハロゲン、ニトロ、アミノ、水酸基、トリフルオロメチル、炭

素数 1～6 個のアルキル、炭素数 1～6 個のアルコキシから選ばれる 1～3 個の置換基を有していてもよい。

一般式 (I) で表される化合物 (以下、化合物 (I) という) のうち、A としては、 $-N(CH_3)-$  または直接結合が好ましい。X, Y はそれぞれ酸素原子または水素 2 原子が好ましい。 $R^2$ ,  $R^3$  は共に水素または共にメチルが好ましい。 $R^4$  は水素が好ましい。 $R^5$ ,  $R^6$  は共にフェニルが好ましい。ただし、A が直接結合、かつ X および Y が共に水素 2 原子、かつ  $R^1$  が水素、かつ  $R^2$ ,  $R^3$  が共に水素である場合を除く。

本発明化合物は分子内に不斉原子を有しているので、光学異性体、ジアステレオ異性体またはこれらの混合物のいずれの形態も包含する。また、本発明はシス・トランス異性体も包含するが、本発明においてはシス異性体が好ましい。

また、本発明化合物は分子内に塩基性基を有することから、通常の有機酸、無機酸と酸付加塩を形成することができる。医薬上許容されうる酸付加塩としては、たとえば酢酸、プロピオン酸、コハク酸、グリコール酸、乳酸、リンゴ酸、酒石酸、クエン酸、アスコルビン酸、マレイン酸、フマル酸、メタンスルホン酸、ベンゼンスルホン酸などの有機酸、塩酸、臭化水素酸、硫酸、磷酸、硝酸などの無機酸との塩である。また、カルボキシル基を有する場合には、金属 (ナトリウム、カリウム、カルシウム、アルミニウムなど)、アミノ酸 (リジン、オルニチンなど) との塩とすることもできる。

化合物 (I) のうち、より好ましい化合物としては、シス-N-〔3-(2-ベンズヒドリルキヌクリジニル)〕-6-クロロ-3, 4-ジヒドロ-4-メチル-2H-1, 4-ベンズオキサジン-8-カルボキサミド、シス-N-〔3-(2-ベンズヒドリルキヌクリジニル)〕-2, 2-ジメチル-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-7-カルボキサミド、シス-N-〔3-(2-ベンズヒドリルキヌクリジニル)〕-2, 2-ジメチル-5-メチルチオ-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-7-カルボキサミド、シス-N-〔3-(2-ベンズヒドリルキヌクリジニル)〕-2, 2-ジメチル-5-ニトロ-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-7-カルボキサミド、シス-3-〔(2, 2-ジメチル-5-ニトロ-2,



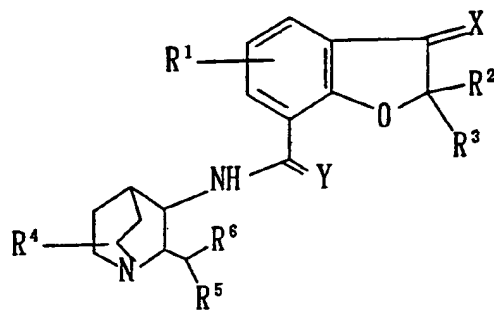
3-ジヒドロベンゾフラン-7-イル) メチル] アミノ-2-ベンズヒドリルキヌクリジン、シス-3-[(2, 2-ジメチル-5-メチルチオ-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-7-イル) メチル] アミノ-2-ベンズヒドリルキヌクリジン、シス-3-[(2, 2-ジメチル-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-7-イル) メチル] アミノ-2-ベンズヒドリルキヌクリジン、シス-3-[(6-クロロ-3, 4-ジヒドロ-4-メチル-2H-1, 4-ベンズオキサジン-8-イル) メチル] アミノ-2-ベンズヒドリルキヌクリジン、シス-N-[3-(2-ベンズヒドリルキヌクリジニル)]-6-クロロ-2, 2-ジメチル-3, 4-ジヒドロ-4-メチル-2H-1, 4-ベンズオキサジン-8-カルボキサミド、シス-N-[3-(2-ベンズヒドリルキヌクリジニル)]-5-メチルチオ-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-7-カルボキサミド、シス-N-[3-(2-ベンズヒドリルキヌクリジニル)]-5-ベンジルチオ-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-7-カルボキサミド、シス-N-[3-(2-ベンズヒドリルキヌクリジニル)]-5-イソプロピルチオ-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-7-カルボキサミド、シス-N-[3-(2-ベンズヒドリルキヌクリジニル)]-2, 2-ジメチル-5-メタンスルホニル-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-7-カルボキサミド、シス-N-[3-(2-ベンズヒドリルキヌクリジニル)]-5-メタンスルホニル-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-7-カルボキサミド、シス-N-[3-(2-ベンズヒドリルキヌクリジニル)]-2, 2-ジメチル-5-ジメチルアミノ-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-7-カルボキサミド、シス-3-[(6-クロロ-3, 4-ジヒドロ-2, 2-ジメチル-4-メチル-2H-1, 4-ベンズオキサジン-8-イル) メチル] アミノ-2-ベンズヒドリルキヌクリジン、シス-3-[(5-メチルチオ-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-7-イル) メチル] アミノ-2-ベンズヒドリルキヌクリジン、シス-3-[(5-ベンジルチオ-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-7-イル) メチル] アミノ-2-ベンズヒドリルキヌクリジン、シス-3-[(5-イソプロピルチオ-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-7-イル) メチル] アミノ-2-ベンズヒドリルキヌクリジン、シス-3-[(2, 2-ジメチル-5-メタンスルホニル

ー2, 3-ジヒドロベンゾフラン-7-イル) メチル) アミノ-2-ベンズヒドリルキヌクリジン、シス-3-〔(5-メタンスルホニル-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-7-イル) メチル) アミノ-2-ベンズヒドリルキヌクリジン、シス-3-〔(2, 2-ジメチル-5-ジメチルアミノ-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-7-イル) メチル) アミノ-2-ベンズヒドリルキヌクリジン、シス-3-〔(5-アセトアミド-2, 2-ジメチル-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-7-イル) メチル) アミノ-2-ベンズヒドリルキヌクリジン、および(ー)ーシス-3-〔(5-メチルチオ-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-7-イル) メチル) アミノ-2-ベンズヒドリルキヌクリジンから選ばれる化合物またはその医薬上許容されうる酸付加塩が挙げられる。

また、本発明は、前記一般式(I)で表されるキヌクリジン化合物またはその医薬上許容されうる酸付加塩の治療上有効量と、医薬上許容されうる添加剤からなる医薬組成物を提供する。

さらに、本発明は、前記一般式(I)で表されるキヌクリジン化合物またはその医薬上許容されうる酸付加塩を有効成分として含有することを特徴とする鎮痛抗炎症薬；咳、喀痰を伴う慢性気管支炎、喘息、鼻炎などの呼吸器系疾患の治療薬；不安症、精神病などの中枢神経系疾患の治療薬；高血圧症、心不全などの循環器系疾患の治療薬；および過敏性大腸炎、潰瘍性大腸炎、クローン病などの消化器系疾患の治療薬を提供する。

前記一般式(I)で表されるキヌクリジン化合物としては次の表に示す化合物が含まれる。



| No. | R <sup>1</sup>                                    | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>                | R <sup>6</sup>                | X              | Y |
|-----|---|----------------|----------------|----------------|-------------------------------|-------------------------------|----------------|---|
| 1   | 5-Cl  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | O |
| 2   | 5-Br  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | O |
| 3   | 5-F   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | O |
| 4   | 5-CH <sub>3</sub>                                 | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | O |
| 5   | 5-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | O |
| 6   | 5-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | O |
| 7   | 5-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>               | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | O |
| 8   | 5-CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | O |
| 9   | 5-OCH <sub>3</sub>                                | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | O |
| 10  | 5-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | O |
| 11  | 5-OCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | O |
| 12  | 5-OC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | O |
| 13  | 5-COCH <sub>3</sub>                               | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | O |
| 14  | 5-OCOCH <sub>3</sub>                              | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | O |
| 15  | 5-OH  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | O |
| 16  | 5-NH <sub>2</sub>                                 | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | O |
| 17  | 5-NO <sub>2</sub>                                 | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | O |
| 18  | 5-CN  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | O |
| 19  | 5-NHCOCH <sub>3</sub>                             | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | O |
| 20  | 5-NHCOC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>               | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | O |

| No. | R <sup>1</sup>                                       | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>                | R <sup>6</sup>                | X              | Y |
|-----|--|----------------|----------------|----------------|-------------------------------|-------------------------------|----------------|---|
| 21  | 5-SCH <sub>3</sub>                                   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | O |
| 22  | 5-SC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                     | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | O |
| 23  | 5-SCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                 | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | O |
| 24  | 5-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                    | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | O |
| 25  | 5-SO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>      | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | O |
| 26  | 5-SO <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | O |
| 27  | 5-SC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                     | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | O |
| 28  | 5-SCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>     | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | O |
| 29  | 5-NHSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | O |
| 30  | 5-NHSO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>    | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | O |
| 31  | 5-NHSO <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>    | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | O |
| 32  | 5-COOH   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | O |
| 33  | 5-COOCH <sub>3</sub>                                 | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | O |
| 34  | 5-COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | O |
| 35  | 5-COOCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | O |
| 36  | 5-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | O |
| 37  | 5-NHCH <sub>3</sub>                                  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | O |
| 38  | 5-NH(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>    | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | O |
| 39  | 5-CONH <sub>2</sub>                                  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | O |
| 40  | 5-CONHCH <sub>3</sub>                                | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | O |
| 41  | 5-CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                 | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | O |
| 42  | 5-OCONHCH <sub>3</sub>                               | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | O |
| 43  | 5-OCON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | O |
| 44  | 5-OCONHCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | O |
| 45  | 5-OCSNHCH <sub>3</sub>                               | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | O |
| 46  | 5-OCSN(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | O |

| No. | R <sup>1</sup>   | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>                | R <sup>6</sup>                | X              | Y |
|-----|--|----------------|----------------|----------------|-------------------------------|-------------------------------|----------------|---|
| 47  | 5-OCSNHCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>             | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 48  | 5-SO <sub>2</sub> NHCH <sub>3</sub>                              | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 49  | 5-SO <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>               | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 50  | 5-SO <sub>2</sub> NHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 51  | 5-SO <sub>2</sub> N(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub> | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 52  | 5-SO <sub>2</sub> NHC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 53  | 5-CF <sub>3</sub>  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 54  | 4-Cl   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 55  | 4-Br   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 56  | 4-F  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 57  | 4-CH <sub>3</sub>  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 58  | 4-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                                  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 59  | 4-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                              | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 60  | 4-CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 61  | 4-OCH <sub>3</sub>   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 62  | 4-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                                 | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 63  | 4-OCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                 | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 64  | 4-OC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                                 | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 65  | 4-COCH <sub>3</sub>  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 66  | 4-OCOCH <sub>3</sub>   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 67  | 4-OH   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 68  | 4-NH <sub>2</sub>  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 69  | 4-NO <sub>2</sub>  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 70  | 4-CN   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 71  | 4-NHCOCH <sub>3</sub>  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |

| No. | R <sup>1</sup>                                       | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>                | R <sup>6</sup>                | X              | Y |
|-----|--|----------------|----------------|----------------|-------------------------------|-------------------------------|----------------|---|
| 72  | 4-NHCOC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 73  | 4-SCH <sub>3</sub>                                   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 74  | 4-SC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                     | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 75  | 4-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>    | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 76  | 4-SCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                 | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 77  | 4-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                    | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 78  | 4-SO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>      | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 79  | 4-SO <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 80  | 4-SC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                     | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 81  | 4-SCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>     | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 82  | 4-NHSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 83  | 4-NHSO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>    | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 84  | 4-NHSO <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>    | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 85  | 4-COOH   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 86  | 4-COOCH <sub>3</sub>                                 | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 87  | 4-COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 88  | 4-COOCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 89  | 4-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 90  | 4-NHCH <sub>3</sub>                                  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 91  | 4-NH(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>    | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 92  | 4-CONH <sub>2</sub>                                  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 93  | 4-CONHCH <sub>3</sub>                                | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 94  | 4-CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                 | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 95  | 4-OCONHCH <sub>3</sub>                               | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 96  | 4-OCON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 97  | 4-OCONHCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |

| No. | R <sup>1</sup>   | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>                | R <sup>6</sup>                | X              | Y |
|-----|--|----------------|----------------|----------------|-------------------------------|-------------------------------|----------------|---|
| 98  | 4-OCSNHCH <sub>3</sub>   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 99  | 4-OCSN(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                            | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 100 | 4-OCSNHCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>             | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 101 | 4-SO <sub>2</sub> NHCH <sub>3</sub>                              | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 102 | 4-SO <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>               | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 103 | 4-SO <sub>2</sub> NHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 104 | 4-SO <sub>2</sub> N(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub> | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 105 | 4-SO <sub>2</sub> NHC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 106 | 4-CF <sub>3</sub>  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 107 | 6-Cl   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 108 | 6-Br   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 109 | 6-F  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 110 | 6-CH <sub>3</sub>  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 111 | 6-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                                  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 112 | 5-SO <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>              | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 113 | 6-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                              | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 114 | 6-CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 115 | 6-OCH <sub>3</sub>   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 116 | 6-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                                 | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 117 | 6-OCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                 | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 118 | 6-OC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                                 | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 119 | 6-COCH <sub>3</sub>  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 120 | 6-OCOCH <sub>3</sub>   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 121 | 6-OH   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 122 | 6-NH <sub>2</sub>  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |

| No. | R <sup>1</sup>                                      | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>                | R <sup>6</sup>                | X              | Y |
|-----|---|----------------|----------------|----------------|-------------------------------|-------------------------------|----------------|---|
| 123 | 6-NO <sub>2</sub>                                   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 124 | 6-CN  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 125 | 6-NHCOCH <sub>3</sub>                               | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 126 | 6-NHCOC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                 | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 127 | 6-SCH <sub>3</sub>                                  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 128 | 6-SC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                    | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 129 | 6-SCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 130 | 6-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 131 | 6-SO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>     | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 132 | 6-SO <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 133 | 6-SC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                    | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 134 | 6-SCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>    | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 135 | 6-NHSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 136 | 6-NHSO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 137 | 6-NHSO <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 138 | 6-COOH  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 139 | 6-COOCH <sub>3</sub>                                | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 140 | 6-COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 141 | 6-COOCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 142 | 6-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 143 | 6-NHCH <sub>3</sub>                                 | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 144 | 6-NH(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 145 | 6-CONH <sub>2</sub>                                 | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 146 | 6-CONHCH <sub>3</sub>                               | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 147 | 6-CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 148 | 6-CONHCH <sub>3</sub>                               | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |



| No. | R <sup>1</sup>   | R <sup>2</sup>  | R <sup>3</sup>  | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>                | R <sup>6</sup>                | X              | Y |
|-----|--|-----------------|-----------------|----------------|-------------------------------|-------------------------------|----------------|---|
| 149 | 6-OCON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                            | H               | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 150 | 6-OCONHCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>             | H               | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 151 | 6-OCSNHCH <sub>3</sub>   | H               | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 152 | 6-OCSN(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                            | H               | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 153 | 6-OCSNHCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>             | H               | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 154 | 6-SO <sub>2</sub> NHCH <sub>3</sub>                              | H               | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 155 | 6-SO <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>               | H               | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 156 | 6-SO <sub>2</sub> NHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                | H               | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 157 | 6-SO <sub>2</sub> N(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub> | H               | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 158 | 6-SO <sub>2</sub> NHC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                | H               | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 159 | 6-CF <sub>3</sub>  | H               | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 160 | H  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 161 | 5-Cl   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 162 | 5-Br   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 163 | 5-F  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 164 | 5-CH <sub>3</sub>  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 165 | 5-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                                  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 166 | 5-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 167 | 5-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                              | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 168 | 5-CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 169 | 5-OCH <sub>3</sub>   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 170 | 5-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                                 | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 171 | 5-OCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                 | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 172 | 5-OC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                                 | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 173 | 5-COCH <sub>3</sub>  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |

| No. | R <sup>1</sup>                                      | R <sup>2</sup>  | R <sup>3</sup>  | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>                | R <sup>6</sup>                | X              | Y |
|-----|---|-----------------|-----------------|----------------|-------------------------------|-------------------------------|----------------|---|
| 174 | 5-OCOCH <sub>3</sub>                                | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 175 | 5-OH  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 176 | 5-NH <sub>2</sub>                                   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 177 | 5-NO <sub>2</sub>                                   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 178 | 5-CN  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 179 | 5-NHCOCH <sub>3</sub>                               | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 180 | 5-NHCOC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                 | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 181 | 5-SCH <sub>3</sub>                                  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 182 | 5-SC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 183 | 5-SCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 184 | 5-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 185 | 5-SO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>     | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 186 | 5-SO <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 187 | 5-SC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 188 | 5-SCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 189 | 5-NHSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 190 | 5-NHSO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 191 | 5-NHSO <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 192 | 5-COOH  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 193 | 5-COOCH <sub>3</sub>                                | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 194 | 5-COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 195 | 5-COOCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 196 | 5-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 197 | 5-NHCH <sub>3</sub>                                 | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 198 | 5-NH(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 199 | 5-CONH <sub>2</sub>                                 | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |

| No. | R <sup>1</sup>   | R <sup>2</sup>  | R <sup>3</sup>  | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>                | R <sup>6</sup>                | X              | Y |
|-----|--|-----------------|-----------------|----------------|-------------------------------|-------------------------------|----------------|---|
| 200 | 5-CONHCH <sub>3</sub>  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 201 | 5-CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                             | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 202 | 5-OCONHCH <sub>3</sub>   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 203 | 5-OCON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                            | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 204 | 5-OCONHCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>             | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 205 | 5-OCSNHCH <sub>3</sub>   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 206 | 5-OCSN(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                            | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 207 | 5-OCSNHCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>             | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 208 | 5-SO <sub>2</sub> NHCH <sub>3</sub>                              | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 209 | 5-SO <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>               | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 210 | 5-SO <sub>2</sub> NHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 211 | 5-SO <sub>2</sub> N(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub> | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 212 | 5-SO <sub>2</sub> NHC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 213 | 5-CF <sub>3</sub>  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 214 | 4-Cl   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 215 | 4-Br   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 216 | 4-F  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 217 | 4-CH <sub>3</sub>  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 218 | 4-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                                  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 219 | 4-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                              | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 220 | 4-CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 221 | 4-OCH <sub>3</sub>   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 222 | 4-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                                 | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 223 | 4-OCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                 | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 224 | 4-OC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                                 | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |

| No. | R <sup>1</sup>                                      | R <sup>2</sup>  | R <sup>3</sup>  | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>                | R <sup>6</sup>                | X              | Y |
|-----|---|-----------------|-----------------|----------------|-------------------------------|-------------------------------|----------------|---|
| 225 | 4-COCH <sub>3</sub>                                 | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | O |
| 226 | 4-OCOCH <sub>3</sub>                                | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | O |
| 227 | 4-OH  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | O |
| 228 | 4-NH <sub>2</sub>                                   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | O |
| 229 | 4-NO <sub>2</sub>                                   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | O |
| 230 | 4-CN  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | O |
| 231 | 4-NHCOCH <sub>3</sub>                               | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | O |
| 232 | 4-NHCOC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                 | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | O |
| 233 | 4-SCH <sub>3</sub>                                  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | O |
| 234 | 4-SC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | O |
| 235 | 4-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | O |
| 236 | 4-SCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | O |
| 237 | 4-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | O |
| 238 | 4-SO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>     | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | O |
| 239 | 4-SO <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | O |
| 240 | 4-SC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | O |
| 241 | 4-SCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | O |
| 242 | 4-NHSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | O |
| 243 | 4-NHSO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | O |
| 244 | 4-NHSO <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | O |
| 245 | 4-COOH  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | O |
| 246 | 4-COOCH <sub>3</sub>                                | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | O |
| 247 | 4-COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | O |
| 248 | 4-COOCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | O |
| 249 | 4-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | O |
| 250 | 4-NHCH <sub>3</sub>                                 | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | O |

| No. | R <sup>1</sup>   | R <sup>2</sup>  | R <sup>3</sup>  | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>                | R <sup>6</sup>                | X              | Y |
|-----|--|-----------------|-----------------|----------------|-------------------------------|-------------------------------|----------------|---|
| 251 | 4-NH(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>                | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 252 | 4-CONH <sub>2</sub>  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 253 | 4-CONHCH <sub>3</sub>  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 254 | 4-CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                             | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 255 | 4-OCONHCH <sub>3</sub>   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 256 | 4-OCON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                            | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 257 | 4-OCONHCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>             | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 258 | 4-OCSNHCH <sub>3</sub>   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 259 | 4-OCSN(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                            | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 260 | 4-OCSNHCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>             | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 261 | 4-SO <sub>2</sub> NHCH <sub>3</sub>                              | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 262 | 4-SO <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>               | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 263 | 4-SO <sub>2</sub> NHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 264 | 4-SO <sub>2</sub> N(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub> | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 265 | 4-SO <sub>2</sub> NHC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 266 | 4-CF <sub>3</sub>  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 267 | 6-Cl   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 268 | 6-Br   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 269 | 6-F  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 270 | 6-CH <sub>3</sub>  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 271 | 6-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                                  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 272 | 6-SO <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>              | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 273 | 6-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                              | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 274 | 6-CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 275 | 6-OCH <sub>3</sub>   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |

| No. | R <sup>1</sup>                                      | R <sup>2</sup>  | R <sup>3</sup>  | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>                | R <sup>6</sup>                | X              | Y |
|-----|---|-----------------|-----------------|----------------|-------------------------------|-------------------------------|----------------|---|
| 276 | 6-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 277 | 6-OCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 278 | 6-OC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 279 | 6-COCH <sub>3</sub>                                 | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 280 | 6-OCOCH <sub>3</sub>                                | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 281 | 6-OH  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 282 | 6-NH <sub>2</sub>                                   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 283 | 6-NO <sub>2</sub>                                   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 284 | 6-CN  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 285 | 6-NHCOCH <sub>3</sub>                               | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 286 | 6-NHCOC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                 | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 287 | 6-SCH <sub>3</sub>                                  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 288 | 6-SC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 289 | 6-SCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 290 | 6-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 291 | 6-SO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>     | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 292 | 6-SO <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 293 | 6-SC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 294 | 6-SCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 295 | 6-NHSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 296 | 6-NHSO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 297 | 6-NHSO <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 298 | 6-COOH  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 299 | 6-COOCH <sub>3</sub>                                | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 300 | 6-COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 301 | 6-COOCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |

| No. | R <sup>1</sup>   | R <sup>2</sup>  | R <sup>3</sup>  | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>                | R <sup>6</sup>                | X              | Y |
|-----|--|-----------------|-----------------|----------------|-------------------------------|-------------------------------|----------------|---|
| 302 | 6-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                               | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 303 | 6-NHCH <sub>3</sub>  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 304 | 6-NH(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>                | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 305 | 6-CONH <sub>2</sub>  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 306 | 6-CONHCH <sub>3</sub>  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 307 | 6-CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                             | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 308 | 6-OCONHCH <sub>3</sub>   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 309 | 6-OCON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                            | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 310 | 6-OCONHCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>             | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 311 | 6-OCSNHCH <sub>3</sub>   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 312 | 6-OCSN(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                            | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 313 | 6-OCSNHCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>             | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 314 | 6-SO <sub>2</sub> NHCH <sub>3</sub>                              | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 315 | 6-SO <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>               | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 316 | 6-SO <sub>2</sub> NHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 317 | 6-SO <sub>2</sub> N(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub> | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 318 | 6-SO <sub>2</sub> NHC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 319 | 6-CF <sub>3</sub>  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 320 | 5-SCH <sub>3</sub>   | CH <sub>3</sub> | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 321 | 5-SC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                                 | CH <sub>3</sub> | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 322 | 5-SCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                             | CH <sub>3</sub> | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 323 | 5-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                                | CH <sub>3</sub> | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 324 | 5-SO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                  | CH <sub>3</sub> | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 325 | 5-SO <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>              | CH <sub>3</sub> | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 326 | 5-SC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                                 | CH <sub>3</sub> | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |

| No. | R <sup>1</sup>                                    | R <sup>2</sup>  | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>                | R <sup>6</sup>                | X              | Y              |
|-----|---|-----------------|----------------|----------------|-------------------------------|-------------------------------|----------------|----------------|
| 327 | 5-CF <sub>3</sub>                                 | CH <sub>3</sub> | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | O              |
| 328 | 5-Cl  | H               | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 329 | 5-Br  | H               | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 330 | 5-F   | H               | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 331 | 5-CH <sub>3</sub>                                 | H               | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 332 | 5-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                   | H               | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 333 | 5-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | H               | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 334 | 5-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>               | H               | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 335 | 5-CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>   | H               | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 336 | 5-OCH <sub>3</sub>                                | H               | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 337 | 5-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                  | H               | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 338 | 5-OCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>  | H               | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 339 | 5-OC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                  | H               | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 340 | 5-COCH <sub>3</sub>                               | H               | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 341 | 5-OCOCH <sub>3</sub>                              | H               | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 342 | 5-OH  | H               | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 343 | 5-NH <sub>2</sub>                                 | H               | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 344 | 5-NO <sub>2</sub>                                 | H               | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 345 | 5-CN  | H               | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 346 | 5-NHCOCH <sub>3</sub>                             | H               | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 347 | 5-NHCOC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>               | H               | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 348 | 5-SCH <sub>3</sub>                                | H               | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 349 | 5-SC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                  | H               | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 350 | 5-SCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>              | H               | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 351 | 5-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | H               | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |



| NO. | R <sup>1</sup>                                       | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>                | R <sup>6</sup>                | X              | Y              |
|-----|--|----------------|----------------|----------------|-------------------------------|-------------------------------|----------------|----------------|
| 352 | 5-SO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>      | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 353 | 5-SO <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 354 | 5-SC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                     | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 355 | 5-SCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>     | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 356 | 5-NHSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 357 | 5-NHSO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>    | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 358 | 5-NHSO <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>    | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 359 | 5-COOH   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 360 | 5-COOCH <sub>3</sub>                                 | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 361 | 5-COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 362 | 5-COOCCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 363 | 5-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 364 | 5-NHCH <sub>3</sub>                                  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 365 | 5-NH(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>    | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 366 | 5-CONH <sub>2</sub>                                  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 367 | 5-CONHCH <sub>3</sub>                                | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 368 | 5-CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                 | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 369 | 5-CONHCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 370 | 5-CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                 | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 371 | 5-CONHCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 372 | 5-OCSNHCH <sub>3</sub>                               | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 373 | 5-OCSN(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 374 | 5-OCSNHCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 375 | 5-SO <sub>2</sub> NHCH <sub>3</sub>                  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 376 | 5-SO <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 377 | 5-SO <sub>2</sub> NHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>    | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |

| NO. | R <sup>1</sup>   | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>                | R <sup>6</sup>                | X              | Y              |
|-----|--|----------------|----------------|----------------|-------------------------------|-------------------------------|----------------|----------------|
| 378 | 5-SO <sub>2</sub> N(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub> | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 379 | 5-SO <sub>2</sub> NHC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 380 | 5-CF <sub>3</sub>  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 381 | 4-Cl   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 382 | 4-Br   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 383 | 4-F  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 384 | 4-CH <sub>3</sub>  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 385 | 4-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                                  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 386 | 4-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                              | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 387 | 4-CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 388 | 4-OCH <sub>3</sub>   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 389 | 4-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                                 | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 390 | 4-OCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                 | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 391 | 4-OC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                                 | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 392 | 4-COCH <sub>3</sub>  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 393 | 4-OCOCH <sub>3</sub>   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 394 | 4-OH   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 395 | 4-NH <sub>2</sub>  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 396 | 4-NO <sub>2</sub>  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 397 | 4-CN   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 398 | 4-NHCOCH <sub>3</sub>  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 399 | 4-NHCOC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                              | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 400 | 4-SCH <sub>3</sub>   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 401 | 4-SC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                                 | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 402 | 4-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |

|     | R <sup>1</sup>                                       | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>                | R <sup>6</sup>                | X              | Y              |
|-----|--|----------------|----------------|----------------|-------------------------------|-------------------------------|----------------|----------------|
| 403 | 4-SCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                 | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 404 | 4-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                    | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 405 | 4-SO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>      | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 406 | 4-SO <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 407 | 4-SC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                     | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 408 | 4-SCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>     | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 409 | 4-NHSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 410 | 4-NHSO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>    | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 411 | 4-NHSO <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>    | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 412 | 4-COOH   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 413 | 4-COOCH <sub>3</sub>                                 | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 414 | 4-COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 415 | 4-COOCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 416 | 4-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 417 | 4-NHCH <sub>3</sub>                                  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 418 | 4-NH(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>    | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 419 | 4-CONH <sub>2</sub>                                  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 420 | 4-CONHCH <sub>3</sub>                                | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 421 | 4-CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                 | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 422 | 4-OCONHCH <sub>3</sub>                               | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 423 | 4-OCON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 424 | 4-OCONHCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 425 | 4-OCSNHCH <sub>3</sub>                               | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 426 | 4-OCSN(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 427 | 4-OCSNHCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 428 | 4-SO <sub>2</sub> NHCH <sub>3</sub>                  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |

|     | R <sup>1</sup>   | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>                | R <sup>6</sup>                | X              | Y              |
|-----|--|----------------|----------------|----------------|-------------------------------|-------------------------------|----------------|----------------|
| 429 | 4-SO <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>               | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 430 | 4-SO <sub>2</sub> NHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 431 | 4-SO <sub>2</sub> N(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub> | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 432 | 4-SO <sub>2</sub> NHC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 433 | 4-CF <sub>3</sub>  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 434 | 6-Cl   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 435 | 6-Br   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 436 | 6-F  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 437 | 6-CH <sub>3</sub>  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 438 | 6-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                                  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 439 | 5-SO <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>              | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 440 | 6-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                              | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 441 | 6-CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 442 | 6-OCH <sub>3</sub>   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 443 | 6-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                                 | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 444 | 6-OCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                 | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 445 | 6-OC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                                 | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 446 | 6-COCH <sub>3</sub>  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 447 | 6-OCOCH <sub>3</sub>   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 448 | 6-OH   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 449 | 6-NH <sub>2</sub>  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 450 | 6-NO <sub>2</sub>  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 451 | 6-CN   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 452 | 6-NHCOCH <sub>3</sub>  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 453 | 6-NHCOC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                              | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |

|     | R <sup>1</sup>                                       | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>                | R <sup>6</sup>                | X              | Y              |
|-----|--|----------------|----------------|----------------|-------------------------------|-------------------------------|----------------|----------------|
| 454 | 6-SCH <sub>3</sub>                                   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 455 | 6-SC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                     | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 456 | 6-SCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                 | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 457 | 6-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                    | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 458 | 6-SO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>      | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 459 | 6-SO <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 460 | 6-SC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                     | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 461 | 6-SCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>     | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 462 | 6-NHSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 463 | 6-NHSO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>    | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 464 | 6-NHSO <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>    | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 465 | 6-COOH   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 466 | 6-COOCH <sub>3</sub>                                 | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 467 | 6-COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 468 | 6-COOCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 469 | 6-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 470 | 6-NHCH <sub>3</sub>                                  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 471 | 6-NH(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>    | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 472 | 6-CONH <sub>2</sub>                                  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 473 | 6-CONHCH <sub>3</sub>                                | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 474 | 6-CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                 | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 475 | 6-OCONHCH <sub>3</sub>                               | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 476 | 6-OCON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 477 | 6-OCONHCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 478 | 6-OCSNHCH <sub>3</sub>                               | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 479 | 6-OCSN(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |

|     | R <sup>1</sup>   | R <sup>2</sup>  | R <sup>3</sup>  | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>                | R <sup>6</sup>                | X              | Y              |
|-----|--|-----------------|-----------------|----------------|-------------------------------|-------------------------------|----------------|----------------|
| 480 | 6-OCSNHCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>             | H               | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 481 | 6-SO <sub>2</sub> NHCH <sub>3</sub>                              | H               | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 482 | 6-SO <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>               | H               | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 483 | 6-SO <sub>2</sub> NHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                | H               | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 484 | 6-SO <sub>2</sub> N(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub> | H               | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 485 | 6-SO <sub>2</sub> NHC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                | H               | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 486 | 6-CF <sub>3</sub>  | H               | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 487 | H  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 488 | 5-Cl   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 489 | 5-Br   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 490 | 5-F  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 491 | 5-CH <sub>3</sub>  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 492 | 5-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                                  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 493 | 5-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 494 | 5-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                              | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 495 | 5-CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 496 | 5-OCH <sub>3</sub>   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 497 | 5-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                                 | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 498 | 5-OCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                 | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 499 | 5-OC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                                 | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 500 | 5-COCH <sub>3</sub>  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 501 | 5-OCOCH <sub>3</sub>   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 502 | 5-OH   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 503 | 5-NH <sub>2</sub>  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 504 | 5-NO <sub>2</sub>  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |

|     | R <sup>1</sup>                                       | R <sup>2</sup>  | R <sup>3</sup>  | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>                | R <sup>6</sup>                | X              | Y              |
|-----|--|-----------------|-----------------|----------------|-------------------------------|-------------------------------|----------------|----------------|
| 505 | 5-CN   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 506 | 5-NHCOC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 507 | 5-SCH <sub>3</sub>                                   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 508 | 5-SC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                     | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 509 | 5-SCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                 | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 510 | 5-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 511 | 5-SO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>      | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 512 | 5-SO <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 513 | 5-SC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                     | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 514 | 5-SCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>     | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 515 | 5-NHSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 516 | 5-NHSO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 517 | 5-NHSO <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 518 | 5-COOH   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 519 | 5-COOCH <sub>3</sub>                                 | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 520 | 5-COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 521 | 5-COOCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 522 | 5-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 523 | 5-NHCH <sub>3</sub>                                  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 524 | 5-NH(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 525 | 5-CONH <sub>2</sub>                                  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 526 | 5-CONHCH <sub>3</sub>                                | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 527 | 5-CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                 | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 528 | 5-OCONHCH <sub>3</sub>                               | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 529 | 5-OCON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 530 | 5-OCONHCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |

|     | R <sup>1</sup>   | R <sup>2</sup>  | R <sup>3</sup>  | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>                | R <sup>6</sup>                | X              | Y              |
|-----|--|-----------------|-----------------|----------------|-------------------------------|-------------------------------|----------------|----------------|
| 531 | 5-OCSNHCH <sub>3</sub>   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 532 | 5-OCSN(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                            | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 533 | 5-OCSNHCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>             | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 534 | 5-SO <sub>2</sub> NHCH <sub>3</sub>                              | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 535 | 5-SO <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>               | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 536 | 5-SO <sub>2</sub> NHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 537 | 5-SO <sub>2</sub> N(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub> | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 538 | 5-SO <sub>2</sub> NHC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 539 | 5-CF <sub>3</sub>  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 540 | 4-Cl   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 541 | 4-Br   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 542 | 4-F  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 543 | 4-CH <sub>3</sub>  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 544 | 4-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                                  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 545 | 4-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                              | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 546 | 4-CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 547 | 4-OCH <sub>3</sub>   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 548 | 4-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                                 | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 549 | 4-OCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                 | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 550 | 4-OC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                                 | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 551 | 4-COCH <sub>3</sub>  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 552 | 4-OCOCH <sub>3</sub>   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 553 | 4-OH   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 554 | 4-NH <sub>2</sub>  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 555 | 4-NO <sub>2</sub>  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |

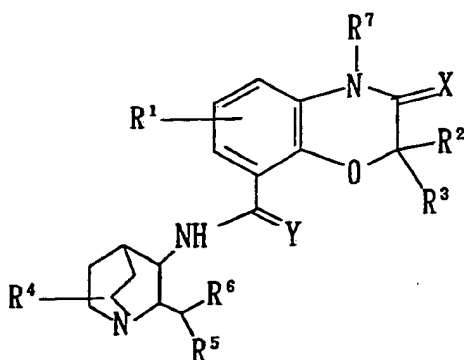


|     | R <sup>1</sup>                                      | R <sup>2</sup>  | R <sup>3</sup>  | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>                | R <sup>6</sup>                | X              | Y              |
|-----|---|-----------------|-----------------|----------------|-------------------------------|-------------------------------|----------------|----------------|
| 556 | 4-CN  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 557 | 4-NHCOCH <sub>3</sub>                               | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 558 | 4-NHCOC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                 | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 559 | 4-SCH <sub>3</sub>                                  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 560 | 4-SC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 561 | 4-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 562 | 4-SCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 563 | 4-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 564 | 4-SO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>     | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 565 | 4-SO <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 566 | 4-SC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 567 | 4-SCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 568 | 4-NHSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 569 | 4-NHSO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 570 | 4-NHSO <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 571 | 4-COOH  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 572 | 4-COOCH <sub>3</sub>                                | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 573 | 4-COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 574 | 4-COOCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 575 | 4-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 576 | 4-NHCH <sub>3</sub>                                 | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 577 | 4-NH(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 578 | 4-CONH <sub>2</sub>                                 | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 579 | 4-CONHCH <sub>3</sub>                               | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 580 | 4-CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 581 | 4-OCONHCH <sub>3</sub>                              | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |

|     | R <sup>1</sup>   | R <sup>2</sup>  | R <sup>3</sup>  | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>                | R <sup>6</sup>                | X              | Y              |
|-----|--|-----------------|-----------------|----------------|-------------------------------|-------------------------------|----------------|----------------|
| 582 | 4-OCON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                            | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 583 | 4-CONHCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>              | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 584 | 4-OCSNHCH <sub>3</sub>   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 585 | 4-OCSN(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                            | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 586 | 4-OCSNHCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>             | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 587 | 4-SO <sub>2</sub> NHCH <sub>3</sub>                              | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 588 | 4-SO <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>               | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 589 | 4-SO <sub>2</sub> NHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 590 | 4-SO <sub>2</sub> N(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub> | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 591 | 4-SO <sub>2</sub> NHC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 592 | 4-CF <sub>3</sub>  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 593 | 6-Cl   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 594 | 6-Br   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 595 | 6-F  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 596 | 6-CH <sub>3</sub>  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 597 | 6-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                                  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 598 | 5-SO <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>              | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 599 | 6-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                              | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 600 | 6-CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 601 | 6-OCH <sub>3</sub>   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 602 | 6-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                                 | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 603 | 6-OCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                 | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 604 | 6-OC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                                 | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 605 | 6-COCH <sub>3</sub>  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 606 | 6-OCOCH <sub>3</sub>   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |

|     | R <sup>1</sup>                                      | R <sup>2</sup>  | R <sup>3</sup>  | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>                | R <sup>6</sup>                | X              | Y              |
|-----|---|-----------------|-----------------|----------------|-------------------------------|-------------------------------|----------------|----------------|
| 607 | 6-OH  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 608 | 6-NH <sub>2</sub>                                   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 609 | 6-NO <sub>2</sub>                                   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 610 | 6-CN  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 611 | 6-NHCOCH <sub>3</sub>                               | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 612 | 6-NHCOC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                 | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 613 | 6-SCH <sub>3</sub>                                  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 614 | 6-SC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 615 | 6-SCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 616 | 6-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 617 | 6-SO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>     | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 618 | 6-SO <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 619 | 6-SC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 620 | 6-SCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 621 | 6-NHSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 622 | 6-NHSO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 623 | 6-NHSO <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 624 | 6-COOH  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 625 | 6-COOCH <sub>3</sub>                                | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 626 | 6-COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 627 | 6-COOCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 628 | 6-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 629 | 6-NHCH <sub>3</sub>                                 | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 630 | 6-NH(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 631 | 6-CONH <sub>2</sub>                                 | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 632 | 6-CONHCH <sub>3</sub>                               | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |

|     | R <sup>1</sup>   | R <sup>2</sup>  | R <sup>3</sup>  | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>                | R <sup>6</sup>                | X              | Y              |
|-----|--|-----------------|-----------------|----------------|-------------------------------|-------------------------------|----------------|----------------|
| 633 | 6-CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                             | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 634 | 6-CONHCH <sub>3</sub>  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 635 | 6-OCON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                            | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 636 | 6-OCONHCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>             | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 637 | 6-OCSNHCH <sub>3</sub>   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 638 | 6-OCSN(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                            | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 639 | 6-OCSNHCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>             | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 640 | 6-SO <sub>2</sub> NHCH <sub>3</sub>                              | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 641 | 6-SO <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>               | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 642 | 6-SO <sub>2</sub> NHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 643 | 6-SO <sub>2</sub> N(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub> | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 644 | 6-SO <sub>2</sub> NHC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 645 | 6-CF <sub>3</sub>  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 646 | 5-SCH <sub>3</sub>   | CH <sub>3</sub> | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 647 | 5-SC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                                 | CH <sub>3</sub> | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 648 | 5-SCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                             | CH <sub>3</sub> | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 649 | 5-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                                | CH <sub>3</sub> | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 650 | 5-SO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                  | CH <sub>3</sub> | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 651 | 5-SO <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>              | CH <sub>3</sub> | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 652 | 5-SC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                                 | CH <sub>3</sub> | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 653 | 5-CF <sub>3</sub>  | CH <sub>3</sub> | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |



| No. | R¹          | R² | R³ | R⁴ | R⁵   | R⁶   | R⁷  | X  | Y |
|-----|-------------|----|----|----|------|------|-----|----|---|
| 654 | 5-Cl        | H  | H  | H  | C₆H₅ | C₆H₅ | CH₃ | H₂ | 0 |
| 655 | 5-Br        | H  | H  | H  | C₆H₅ | C₆H₅ | CH₃ | H₂ | 0 |
| 656 | 5-F         | H  | H  | H  | C₆H₅ | C₆H₅ | CH₃ | H₂ | 0 |
| 657 | 5-CH₃       | H  | H  | H  | C₆H₅ | C₆H₅ | CH₃ | H₂ | 0 |
| 658 | 5-C₂H₅      | H  | H  | H  | C₆H₅ | C₆H₅ | CH₃ | H₂ | 0 |
| 659 | 5-CH₂CH₂CH₃ | H  | H  | H  | C₆H₅ | C₆H₅ | CH₃ | H₂ | 0 |
| 660 | 5-CH(CH₃)₂  | H  | H  | H  | C₆H₅ | C₆H₅ | CH₃ | H₂ | 0 |
| 661 | 5-CH₂C₆H₅   | H  | H  | H  | C₆H₅ | C₆H₅ | CH₃ | H₂ | 0 |
| 662 | 5-OCH₃      | H  | H  | H  | C₆H₅ | C₆H₅ | CH₃ | H₂ | 0 |
| 663 | 5-OC₂H₅     | H  | H  | H  | C₆H₅ | C₆H₅ | CH₃ | H₂ | 0 |
| 664 | 5-OCH₂C₆H₅  | H  | H  | H  | C₆H₅ | C₆H₅ | CH₃ | H₂ | 0 |
| 665 | 5-OC₆H₅     | H  | H  | H  | C₆H₅ | C₆H₅ | CH₃ | H₂ | 0 |
| 666 | 5-COCH₃     | H  | H  | H  | C₆H₅ | C₆H₅ | CH₃ | H₂ | 0 |
| 667 | 5-OCOCH₃    | H  | H  | H  | C₆H₅ | C₆H₅ | CH₃ | H₂ | 0 |
| 668 | 5-OH        | H  | H  | H  | C₆H₅ | C₆H₅ | CH₃ | H₂ | 0 |
| 669 | 5-NH₂       | H  | H  | H  | C₆H₅ | C₆H₅ | CH₃ | H₂ | 0 |
| 670 | 5-NO₂       | H  | H  | H  | C₆H₅ | C₆H₅ | CH₃ | H₂ | 0 |
| 671 | 5-CN        | H  | H  | H  | C₆H₅ | C₆H₅ | CH₃ | H₂ | 0 |
| 672 | 5-NHCOCH₃   | H  | H  | H  | C₆H₅ | C₆H₅ | CH₃ | H₂ | 0 |

| No. | R <sup>1</sup>                                       | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>                | R <sup>6</sup>                | R <sup>7</sup>  | X              | Y |
|-----|--|----------------|----------------|----------------|-------------------------------|-------------------------------|-----------------|----------------|---|
| 673 | 5-NHCOC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 674 | 5-SCH <sub>3</sub>                                   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 675 | 5-SC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                     | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 676 | 5-SCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                 | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 677 | 5-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                    | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 678 | 5-SO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>      | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 679 | 5-SO <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 680 | 5-SC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                     | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 681 | 5-SCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>     | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 682 | 5-NHSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 683 | 5-NHSO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>    | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 684 | 5-NHSO <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>    | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 685 | 5-COOH   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 686 | 5-COOCH <sub>3</sub>                                 | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 687 | 5-COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 688 | 5-COOCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 689 | 5-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 690 | 5-NHCH <sub>3</sub>                                  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 691 | 5-NH(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>    | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 692 | 5-CONH <sub>2</sub>                                  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 693 | 5-CONHCH <sub>3</sub>                                | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 694 | 5-CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                 | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 695 | 5-OCONHCH <sub>3</sub>                               | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 696 | 5-OCON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 697 | 5-OCONHCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 698 | 5-OCSNHCH <sub>3</sub>                               | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |

| No. | R <sup>1</sup>   | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>                | R <sup>6</sup>                | R <sup>7</sup>  | X              | Y |
|-----|--|----------------|----------------|----------------|-------------------------------|-------------------------------|-----------------|----------------|---|
| 699 | 5-OCSN(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                            | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 700 | 5-OCSNHCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>             | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 701 | 5-SO <sub>2</sub> NHCH <sub>3</sub>                              | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 702 | 5-SO <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>               | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 703 | 5-SO <sub>2</sub> NHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 704 | 5-SO <sub>2</sub> N(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub> | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 705 | 5-SO <sub>2</sub> NHC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 706 | 5-CF <sub>3</sub>  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 707 | 7-Cl   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 708 | 7-Br   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 709 | 7-F  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 710 | 7-CH <sub>3</sub>  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 711 | 7-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                                  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 712 | 7-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                              | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 713 | 7-CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 714 | 7-OCH <sub>3</sub>   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 715 | 7-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                                 | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 716 | 7-OCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                 | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 717 | 7-OC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                                 | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 718 | 7-COCH <sub>3</sub>  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 719 | 7-OCOCH <sub>3</sub>   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 720 | 7-OH   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 721 | 7-NH <sub>2</sub>  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 722 | 7-NO <sub>2</sub>  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 723 | 7-CN   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |

| No. | R <sup>1</sup>                                      | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>                | R <sup>6</sup>                | R <sup>7</sup>  | X              | Y |
|-----|---|----------------|----------------|----------------|-------------------------------|-------------------------------|-----------------|----------------|---|
| 724 | 7-NHCOCH <sub>3</sub>                               | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 725 | 7-NHCOC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                 | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 726 | 7-SCH <sub>3</sub>                                  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 727 | 7-SC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                    | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 728 | 7-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 729 | 7-SCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 730 | 7-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 731 | 7-SO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>     | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 732 | 7-SO <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 733 | 7-SC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                    | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 734 | 7-SCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>    | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 735 | 7-NHSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 736 | 7-NHSO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 737 | 7-NHSO <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 738 | 7-COOH  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 739 | 7-COOCH <sub>3</sub>                                | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 740 | 7-COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 741 | 7-COOCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 742 | 7-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 743 | 7-NHCH <sub>3</sub>                                 | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 744 | 7-NH(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 745 | 7-CONH <sub>2</sub>                                 | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 746 | 7-CONHCH <sub>3</sub>                               | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 747 | 7-CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 748 | 7-OCONHCH <sub>3</sub>                              | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 749 | 7-OCON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>               | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |



| No. | R <sup>1</sup>   | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>                | R <sup>6</sup>                | R <sup>7</sup>  | X              | Y |
|-----|--|----------------|----------------|----------------|-------------------------------|-------------------------------|-----------------|----------------|---|
| 750 | 7-OCONHCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>             | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 751 | 7-OCSNHCH <sub>3</sub>   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 752 | 7-OCSN(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                            | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 753 | 7-OCSNHCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>             | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 754 | 7-SO <sub>2</sub> NHCH <sub>3</sub>                              | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 755 | 7-SO <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>               | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 756 | 7-SO <sub>2</sub> NHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 757 | 7-SO <sub>2</sub> N(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub> | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 758 | 7-SO <sub>2</sub> NHC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 759 | 7-CF <sub>3</sub>  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 760 | 6-Cl   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 761 | 6-Br   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 762 | 6-F  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 763 | 6-CH <sub>3</sub>  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 764 | 6-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                                  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 765 | 6-SO <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>              | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 766 | 6-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                              | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 767 | 6-CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 768 | 6-OCH <sub>3</sub>   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 769 | 6-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                                 | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 770 | 6-OCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                 | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 771 | 6-OC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                                 | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 772 | 6-COCH <sub>3</sub>  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 773 | 6-OCOCH <sub>3</sub>   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 774 | 6-OH   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |

| No. | R <sup>1</sup>                                      | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>                | R <sup>6</sup>                | R <sup>7</sup>  | X              | Y |
|-----|---|----------------|----------------|----------------|-------------------------------|-------------------------------|-----------------|----------------|---|
| 775 | 6-NH <sub>2</sub>                                   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 776 | 6-NO <sub>2</sub>                                   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 777 | 6-CN  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 778 | 6-NHCOCH <sub>3</sub>                               | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 779 | 6-NHCOC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                 | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 780 | 6-SCH <sub>3</sub>                                  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 781 | 6-SC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                    | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 782 | 6-SCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 783 | 6-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 784 | 6-SO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>     | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 785 | 6-SO <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 786 | 6-SC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                    | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 787 | 6-SCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>    | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 788 | 6-NHSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 789 | 6-NHSO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 790 | 6-NHSO <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 791 | 6-COOH  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 792 | 6-COOCH <sub>3</sub>                                | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 793 | 6-COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 794 | 6-COOCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 795 | 6-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 796 | 6-NHCH <sub>3</sub>                                 | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 797 | 6-NH(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 798 | 6-CONH <sub>2</sub>                                 | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 799 | 6-CONHCH <sub>3</sub>                               | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 800 | 6-CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |

| No. | R <sup>1</sup>   | R <sup>2</sup>  | R <sup>3</sup>  | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>                | R <sup>6</sup>                | R <sup>7</sup>  | X              | Y |
|-----|--|-----------------|-----------------|----------------|-------------------------------|-------------------------------|-----------------|----------------|---|
| 801 | 6-OCONHCH <sub>3</sub>   | H               | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 802 | 6-OCON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                            | H               | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 803 | 6-OCONHCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>             | H               | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 804 | 6-OCSNHCH <sub>3</sub>   | H               | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 805 | 6-OCSN(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                            | H               | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 806 | 6-OCSNHCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>             | H               | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 807 | 6-SO <sub>2</sub> NHCH <sub>3</sub>                              | H               | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 808 | 6-SO <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>               | H               | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 809 | 6-SO <sub>2</sub> NHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                | H               | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 810 | 6-SO <sub>2</sub> N(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub> | H               | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 811 | 6-SO <sub>2</sub> NHC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                | H               | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 812 | 6-CF <sub>3</sub>  | H               | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 813 | 6-Cl   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 814 | 6-Br   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 815 | 6-F  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 816 | 6-CH <sub>3</sub>  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 817 | 6-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                                  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 818 | 6-SO <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>              | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 819 | 6-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                              | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 820 | 6-CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 821 | 6-OCH <sub>3</sub>   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 822 | 6-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                                 | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 823 | 6-OCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                 | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 824 | 6-OC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                                 | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |
| 825 | 6-COCH <sub>3</sub>  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0 |

| No. | R <sup>1</sup>                                      | R <sup>2</sup>  | R <sup>3</sup>  | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>                | R <sup>6</sup>                | R <sup>7</sup>  | X              | Y |
|-----|---|-----------------|-----------------|----------------|-------------------------------|-------------------------------|-----------------|----------------|---|
| 826 | 6-OCOCH <sub>3</sub>                                | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | O |
| 827 | 6-OH  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | O |
| 828 | 6-NH <sub>2</sub>                                   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | O |
| 829 | 6-NO <sub>2</sub>                                   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | O |
| 830 | 6-CN  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | O |
| 831 | 6-NHCOCH <sub>3</sub>                               | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | O |
| 832 | 6-NHCOC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                 | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | O |
| 833 | 6-SCH <sub>3</sub>                                  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | O |
| 834 | 6-SC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | O |
| 835 | 6-SCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | O |
| 836 | 6-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | O |
| 837 | 6-SO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>     | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | O |
| 838 | 6-SO <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | O |
| 839 | 6-SC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | O |
| 840 | 6-SCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | O |
| 841 | 6-NHSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | O |
| 842 | 6-NHSO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | O |
| 843 | 6-NHSO <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | O |
| 844 | 6-COOH  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | O |
| 845 | 6-COOCH <sub>3</sub>                                | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | O |
| 846 | 6-COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | O |
| 847 | 6-COOCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | O |
| 848 | 6-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | O |
| 849 | 6-NHCH <sub>3</sub>                                 | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | O |
| 850 | 6-NH(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | O |
| 851 | 6-CONH <sub>2</sub>                                 | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | O |

| No. | R <sup>1</sup>   | R <sup>2</sup>  | R <sup>3</sup>  | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>                | R <sup>6</sup>                | R <sup>7</sup>  | X              | Y              |
|-----|--|-----------------|-----------------|----------------|-------------------------------|-------------------------------|-----------------|----------------|----------------|
| 852 | 6-CONHCH <sub>3</sub>  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0              |
| 853 | 6-CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                             | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0              |
| 854 | 6-OCONHCH <sub>3</sub>   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0              |
| 855 | 6-OCON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                            | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0              |
| 856 | 6-OCONHCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>             | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0              |
| 857 | 6-OCSNHCH <sub>3</sub>   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0              |
| 858 | 6-OCSN(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                            | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0              |
| 859 | 6-OCSNHCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>             | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0              |
| 860 | 6-SO <sub>2</sub> NHCH <sub>3</sub>                              | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0              |
| 861 | 6-SO <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>               | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0              |
| 862 | 6-SO <sub>2</sub> NHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0              |
| 863 | 6-SO <sub>2</sub> N(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub> | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0              |
| 864 | 6-SO <sub>2</sub> NHC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0              |
| 865 | 6-CF <sub>3</sub>  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | 0              |
| 866 | 5-Cl   | H               | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 867 | 5-Br   | H               | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 868 | 5-F  | H               | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 869 | 5-CH <sub>3</sub>  | H               | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 870 | 5-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                                  | H               | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 871 | 5-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                | H               | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 872 | 5-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                              | H               | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 873 | 5-CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                  | H               | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 874 | 5-OCH <sub>3</sub>   | H               | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 875 | 5-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                                 | H               | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 876 | 5-OCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                 | H               | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |

| No. | R <sup>1</sup>                                      | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>                | R <sup>6</sup>                | R <sup>7</sup>  | X              | Y              |
|-----|---|----------------|----------------|----------------|-------------------------------|-------------------------------|-----------------|----------------|----------------|
| 877 | 5-OC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                    | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 878 | 5-COCH <sub>3</sub>                                 | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 879 | 5-OCOCH <sub>3</sub>                                | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 880 | 5-OH  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 881 | 5-NH <sub>2</sub>                                   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 882 | 5-NO <sub>2</sub>                                   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 883 | 5-CN  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 884 | 5-NHCOCH <sub>3</sub>                               | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 885 | 5-NHCOC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                 | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 886 | 5-SCH <sub>3</sub>                                  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 887 | 5-SC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                    | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 888 | 5-SCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 889 | 5-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 890 | 5-SO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>     | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 891 | 5-SO <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 892 | 5-SC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                    | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 893 | 5-SCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>    | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 894 | 5-NHSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 895 | 5-NHSO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 896 | 5-NHSO <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 897 | 5-COOH  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 898 | 5-COOCH <sub>3</sub>                                | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 899 | 5-COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 900 | 5-COOCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 901 | 5-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |

| No. | R <sup>1</sup>   | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>                | R <sup>6</sup>                | R <sup>7</sup>  | X              | Y              |
|-----|--|----------------|----------------|----------------|-------------------------------|-------------------------------|-----------------|----------------|----------------|
| 902 | 5-NHCH <sub>3</sub>  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 903 | 5-NH(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>                | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 904 | 5-CONH <sub>2</sub>  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 905 | 5-CONHCH <sub>3</sub>  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 906 | 5-CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                             | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 907 | 5-OCONHCH <sub>3</sub>   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 908 | 5-OCON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                            | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 909 | 5-OCONHCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>             | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 910 | 5-OCSNHCH <sub>3</sub>   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 911 | 5-OCSN(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                            | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 912 | 5-OCSNHCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>             | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 913 | 5-SO <sub>2</sub> NHCH <sub>3</sub>                              | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 914 | 5-SO <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>               | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 915 | 5-SO <sub>2</sub> NHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 916 | 5-SO <sub>2</sub> N(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub> | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 917 | 5-SO <sub>2</sub> NHC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 918 | 5-CF <sub>3</sub>  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 919 | 7-Cl   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 920 | 7-Br   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 921 | 7-F  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 922 | 7-CH <sub>3</sub>  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 923 | 7-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                                  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 924 | 7-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                              | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 925 | 7-CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 926 | 7-OCH <sub>3</sub>   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |

| No. | R <sup>1</sup>                                      | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>                | R <sup>6</sup>                | R <sup>7</sup>  | X              | Y              |
|-----|---|----------------|----------------|----------------|-------------------------------|-------------------------------|-----------------|----------------|----------------|
| 927 | 7-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                    | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 928 | 7-0CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>    | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 929 | 7-OC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                    | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 930 | 7-COCH <sub>3</sub>                                 | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 931 | 7-OCOCH <sub>3</sub>                                | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 932 | 7-OH  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 933 | 7-NH <sub>2</sub>                                   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 934 | 7-NO <sub>2</sub>                                   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 935 | 7-CN  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 936 | 7-NHCOCH <sub>3</sub>                               | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 937 | 7-NHCOC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                 | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 938 | 7-SCH <sub>3</sub>                                  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 939 | 7-SC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                    | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 940 | 7-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 941 | 7-SCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 942 | 7-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 943 | 7-SO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>     | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 944 | 7-SO <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 945 | 7-SC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                    | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 946 | 7-SCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>    | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 947 | 7-NHSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 948 | 7-NHSO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 949 | 7-NHSO <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 950 | 7-COOH  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 951 | 7-COOCH <sub>3</sub>                                | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 952 | 7-COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |



| No. | R <sup>1</sup>   | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>                | R <sup>6</sup>                | R <sup>7</sup>  | X              | Y              |
|-----|--|----------------|----------------|----------------|-------------------------------|-------------------------------|-----------------|----------------|----------------|
| 953 | 7-COOCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>               | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 954 | 7-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                               | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 955 | 7-NHCH <sub>3</sub>  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 956 | 7-NH(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>                | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 957 | 7-CONH <sub>2</sub>  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 958 | 7-CONHCH <sub>3</sub>  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 959 | 7-CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                             | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 960 | 7-OCONHCH <sub>3</sub>   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 961 | 7-OCON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                            | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 962 | 7-OCONHCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>             | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 963 | 7-OCSNHCH <sub>3</sub>   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 964 | 7-OCSN(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                            | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 965 | 7-OCSNHCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>             | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 966 | 7-SO <sub>2</sub> NHCH <sub>3</sub>                              | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 967 | 7-SO <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>               | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 968 | 7-SO <sub>2</sub> NHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 969 | 7-SO <sub>2</sub> N(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub> | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 970 | 7-SO <sub>2</sub> NHC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 971 | 7-CF <sub>3</sub>  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 972 | 6-Cl   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 973 | 6-Br   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 974 | 6-F  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 975 | 6-CH <sub>3</sub>  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 976 | 6-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                                  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 977 | 6-SO <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>              | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |

| No.  | R <sup>1</sup>                                      | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>                | R <sup>6</sup>                | R <sup>7</sup>  | X              | Y              |
|------|---|----------------|----------------|----------------|-------------------------------|-------------------------------|-----------------|----------------|----------------|
| 978  | 6-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                 | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 979  | 6-CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>     | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 980  | 6-OCH <sub>3</sub>                                  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 981  | 6-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                    | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 982  | 6-OCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>    | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 983  | 6-OC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                    | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 984  | 6-COCH <sub>3</sub>                                 | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 985  | 6-OCOCH <sub>3</sub>                                | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 986  | 6-OH  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 987  | 6-NH <sub>2</sub>                                   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 988  | 6-NO <sub>2</sub>                                   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 989  | 6-CN  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 990  | 6-NHCOCH <sub>3</sub>                               | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 991  | 6-NHCOC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                 | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 992  | 6-SCH <sub>3</sub>                                  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 993  | 6-SC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                    | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 994  | 6-SCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 995  | 6-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 996  | 6-SO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>     | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 997  | 6-SO <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 998  | 6-SC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                    | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 999  | 6-SCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>    | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 1000 | 6-NHSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 1001 | 6-NHSO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 1002 | 6-NHSO <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 1003 | 6-COOH  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |

| No.  | R <sup>1</sup>   | R <sup>2</sup>  | R <sup>3</sup>  | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>                | R <sup>6</sup>                | R <sup>7</sup>  | X              | Y              |
|------|--|-----------------|-----------------|----------------|-------------------------------|-------------------------------|-----------------|----------------|----------------|
| 1004 | 6-COOCH <sub>3</sub>   | H               | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 1005 | 6-COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                               | H               | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 1006 | 6-COOCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>               | H               | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 1007 | 6-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                               | H               | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 1008 | 6-NHCH <sub>3</sub>  | H               | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 1009 | 6-NH(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>                | H               | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 1010 | 6-CONH <sub>2</sub>  | H               | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 1011 | 6-CONHCH <sub>3</sub>  | H               | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 1012 | 6-CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                             | H               | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 1013 | 6-CONHCH <sub>2</sub>  | H               | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 1014 | 6-CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                             | H               | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 1015 | 6-CONHCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>              | H               | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 1016 | 6-OCSNHCH <sub>3</sub>   | H               | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 1017 | 6-OCSN(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                            | H               | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 1018 | 6-OCSNHCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>             | H               | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 1019 | 6-SO <sub>2</sub> NHCH <sub>3</sub>                              | H               | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 1020 | 6-SO <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>               | H               | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 1021 | 6-SO <sub>2</sub> NHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                | H               | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 1022 | 6-SO <sub>2</sub> N(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub> | H               | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 1023 | 6-SO <sub>2</sub> NHC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                | H               | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 1024 | 6-CF <sub>3</sub>  | H               | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 1025 | 6-Cl   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 1026 | 6-Br   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 1027 | 6-F  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 1028 | 6-CH <sub>3</sub>  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |

| No.  | R <sup>1</sup>                                      | R <sup>2</sup>  | R <sup>3</sup>  | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>                | R <sup>6</sup>                | R <sup>7</sup>  | X              | Y              |
|------|---|-----------------|-----------------|----------------|-------------------------------|-------------------------------|-----------------|----------------|----------------|
| 1029 | 6-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                     | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 1030 | 6-SO <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 1031 | 6-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                 | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 1032 | 6-CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>     | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 1033 | 6-OCH <sub>3</sub>                                  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 1034 | 6-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 1035 | 6-OCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 1036 | 6-OC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 1037 | 6-COCH <sub>3</sub>                                 | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 1038 | 6-OCOCH <sub>3</sub>                                | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 1039 | 6-OH  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 1040 | 6-NH <sub>2</sub>                                   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 1041 | 6-NO <sub>2</sub>                                   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 1042 | 6-CN  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 1043 | 6-NHCOCH <sub>3</sub>                               | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 1044 | 6-NHCOC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                 | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 1045 | 6-SCH <sub>3</sub>                                  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 1046 | 6-SC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 1047 | 6-SCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 1048 | 6-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 1049 | 6-SO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>     | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 1050 | 6-SO <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 1051 | 6-SC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 1052 | 6-SCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 1053 | 6-NHSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 1054 | 6-NHSO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |

| No.  | R <sup>1</sup>   | R <sup>2</sup>  | R <sup>3</sup>  | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>                | R <sup>6</sup>                | R <sup>7</sup>  | X              | Y              |
|------|--|-----------------|-----------------|----------------|-------------------------------|-------------------------------|-----------------|----------------|----------------|
| 1055 | 6-NHSO <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 1056 | 6-COOH   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 1057 | 6-COOCH <sub>3</sub>   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 1058 | 6-COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                               | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 1059 | 6-COOCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>               | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 1060 | 6-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                               | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 1061 | 6-NHCH <sub>3</sub>  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 1062 | 6-NH(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>                | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 1063 | 6-CONH <sub>2</sub>  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 1064 | 6-CONHCH <sub>3</sub>  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 1065 | 6-CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                             | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 1066 | 6-CONHCH <sub>3</sub>  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 1067 | 6-CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                             | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 1068 | 6-CONHCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>              | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 1069 | 6-OCSNHCH <sub>3</sub>   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 1070 | 6-OCSN(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                            | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 1071 | 6-OCSNHCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>             | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 1072 | 6-SO <sub>2</sub> NHCH <sub>3</sub>                              | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 1073 | 6-SO <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>               | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 1074 | 6-SO <sub>2</sub> NHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 1075 | 6-SO <sub>2</sub> N(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub> | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 1076 | 6-SO <sub>2</sub> NHC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 1077 | 6-CF <sub>3</sub>  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 1078 | 5-Cl   | H               | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | O              | O              |
| 1079 | 5-Br   | H               | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | O              | O              |

| No.  | R <sup>1</sup>                                      | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>                | R <sup>6</sup>                | R <sup>7</sup>  | X | Y |
|------|---|----------------|----------------|----------------|-------------------------------|-------------------------------|-----------------|---|---|
| 1080 | 5-F   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1081 | 5-CH <sub>3</sub>                                   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1082 | 5-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                     | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1083 | 5-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1084 | 5-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                 | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1085 | 5-CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>     | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1086 | 5-OCH <sub>3</sub>                                  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1087 | 5-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                    | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1088 | 5-OCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>    | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1089 | 5-OC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                    | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1090 | 5-COCH <sub>3</sub>                                 | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1091 | 5-OCOCH <sub>3</sub>                                | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1092 | 5-OH  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1093 | 5-NH <sub>2</sub>                                   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1094 | 5-NO <sub>2</sub>                                   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1095 | 5-CN  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1096 | 5-NHCOCH <sub>3</sub>                               | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1097 | 5-NHCOC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                 | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1098 | 5-SCH <sub>3</sub>                                  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1099 | 5-SC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                    | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1100 | 5-SCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1101 | 5-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1102 | 5-SO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>     | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1103 | 5-SO <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1104 | 5-SC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                    | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1105 | 5-SCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>    | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |

| No.  | R <sup>1</sup>   | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>                | R <sup>6</sup>                | R <sup>7</sup>  | X | Y |
|------|--|----------------|----------------|----------------|-------------------------------|-------------------------------|-----------------|---|---|
| 1106 | 5-NHSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                              | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1107 | 5-NHSO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1108 | 5-NHSO <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1109 | 5-COOH   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1110 | 5-COOCH <sub>3</sub>   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1111 | 5-COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                               | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1112 | 5-COOCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>               | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1113 | 5-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                               | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1114 | 5-NHCH <sub>3</sub>  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1115 | 5-NH(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>                | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1116 | 5-CONH <sub>2</sub>  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1117 | 5-CONHCH <sub>3</sub>  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1118 | 5-CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                             | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1119 | 5-CONHCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>              | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1120 | 5-CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                             | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1121 | 5-CONHCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>              | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1122 | 5-OCSNHCH <sub>3</sub>   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1123 | 5-OCSN(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                            | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1124 | 5-OCSNHCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>             | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1125 | 5-SO <sub>2</sub> NHCH <sub>3</sub>                              | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1126 | 5-SO <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>               | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1127 | 5-SO <sub>2</sub> NHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1128 | 5-SO <sub>2</sub> N(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub> | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1129 | 5-SO <sub>2</sub> NHC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1130 | 5-CF <sub>3</sub>  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |

| No.  | R <sup>1</sup>                                      | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>                | R <sup>6</sup>                | R <sup>7</sup>  | X | Y |
|------|---|----------------|----------------|----------------|-------------------------------|-------------------------------|-----------------|---|---|
| 1131 | 7-Cl  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1132 | 7-Br  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1133 | 7-F   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1134 | 7-CH <sub>3</sub>                                   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1135 | 7-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                     | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1136 | 7-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                 | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1137 | 7-CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>     | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1138 | 7-OCH <sub>3</sub>                                  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1139 | 7-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                    | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1140 | 7-OCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>    | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1141 | 7-OC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                    | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1142 | 7-COCH <sub>3</sub>                                 | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1143 | 7-OCOCH <sub>3</sub>                                | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1144 | 7-OH  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1145 | 7-NH <sub>2</sub>                                   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1146 | 7-NO <sub>2</sub>                                   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1147 | 7-CN  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1148 | 7-NHCOCH <sub>3</sub>                               | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1149 | 7-NHCOC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                 | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1150 | 7-SCH <sub>3</sub>                                  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1151 | 7-SC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                    | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1152 | 7-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1153 | 7-SCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1154 | 7-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1155 | 7-SO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>     | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1156 | 7-SO <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |



| No.  | R <sup>1</sup>   | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>                | R <sup>6</sup>                | R <sup>7</sup>  | X | Y |
|------|--|----------------|----------------|----------------|-------------------------------|-------------------------------|-----------------|---|---|
| 1157 | 7-SC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                                 | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1158 | 7-SCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                 | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1159 | 7-NHSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                              | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1160 | 7-NHSO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1161 | 7-NHSO <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1162 | 7-COOH   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1163 | 7-COOCH <sub>3</sub>   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1164 | 7-COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                               | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1165 | 7-COOCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>               | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1166 | 7-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                               | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1167 | 7-NHCH <sub>3</sub>  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1168 | 7-NH(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>                | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1169 | 7-CONH <sub>2</sub>  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1170 | 7-CONHCH <sub>3</sub>  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1171 | 7-CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                             | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1172 | 7-CONHCH <sub>3</sub>  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1173 | 7-CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                             | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1174 | 7-CONHCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>              | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1175 | 7-OCSNHCH <sub>3</sub>   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1176 | 7-OCSN(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                            | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1177 | 7-OCSNHCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>             | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1178 | 7-SO <sub>2</sub> NHCH <sub>3</sub>                              | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1179 | 7-SO <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>               | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1180 | 7-SO <sub>2</sub> NHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1181 | 7-SO <sub>2</sub> N(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub> | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1182 | 7-SO <sub>2</sub> NHC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |

| No.  | R <sup>1</sup>                                      | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>                | R <sup>6</sup>                | R <sup>7</sup>  | X | Y |
|------|---|----------------|----------------|----------------|-------------------------------|-------------------------------|-----------------|---|---|
| 1183 | 7-CF <sub>3</sub>                                   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1184 | 6-Cl  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1185 | 6-Br  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1186 | 6-F   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1187 | 6-CH <sub>3</sub>                                   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1188 | 6-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                     | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1189 | 6-SO <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1190 | 6-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                 | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1191 | 6-CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>     | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1192 | 6-OCH <sub>3</sub>                                  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1193 | 6-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                    | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1194 | 6-OCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>    | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1195 | 6-OC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                    | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1196 | 6-COCH <sub>3</sub>                                 | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1197 | 6-OCOCH <sub>3</sub>                                | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1198 | 6-OH  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1199 | 6-NH <sub>2</sub>                                   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1200 | 6-NO <sub>2</sub>                                   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1201 | 6-CN  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1202 | 6-NHCOCH <sub>3</sub>                               | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1203 | 6-NHCOC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                 | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1204 | 6-SCH <sub>3</sub>                                  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1205 | 6-SC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                    | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1206 | 6-SCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1207 | 6-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |

| No.  | R <sup>1</sup>                                       | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>                | R <sup>6</sup>                | R <sup>7</sup>  | X | Y |
|------|--|----------------|----------------|----------------|-------------------------------|-------------------------------|-----------------|---|---|
| 1208 | 6-SO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>      | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1209 | 6-SO <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1210 | 6-SC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                     | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1211 | 6-SCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>     | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1212 | 6-NHSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1213 | 6-NHSO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>    | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1214 | 6-NHSO <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>    | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1215 | 6-COOH   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1216 | 6-COOCH <sub>3</sub>                                 | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1217 | 6-COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1218 | 6-COOCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1219 | 6-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1220 | 6-NHCH <sub>3</sub>                                  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1221 | 6-NH(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>    | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1222 | 6-CONH <sub>2</sub>                                  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1223 | 6-CONHCH <sub>3</sub>                                | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1224 | 6-CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                 | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1225 | 6-OCONHCH <sub>3</sub>                               | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1226 | 6-OCON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1227 | 6-OCONHCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1228 | 6-OCSNHCH <sub>3</sub>                               | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1229 | 6-OCSN(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1230 | 6-OCSNHCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1231 | 6-SO <sub>2</sub> NHCH <sub>3</sub>                  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1232 | 6-SO <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1233 | 6-SO <sub>2</sub> NHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>    | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |

| No.  | R <sup>1</sup>   | R <sup>2</sup>  | R <sup>3</sup>  | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>                | R <sup>6</sup>                | R <sup>7</sup>  | X | Y |
|------|--|-----------------|-----------------|----------------|-------------------------------|-------------------------------|-----------------|---|---|
| 1234 | 6-SO <sub>2</sub> N(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub> | H               | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1235 | 6-SO <sub>2</sub> NHC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                | H               | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1236 | 6-CF <sub>3</sub>  | H               | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1237 | 6-Cl   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1238 | 6-Br   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1239 | 6-F  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1240 | 6-CH <sub>3</sub>  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1241 | 6-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                                  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1242 | 6-SO <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>              | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1243 | 6-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                              | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1244 | 6-CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1245 | 6-OCH <sub>3</sub>   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1246 | 6-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                                 | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1247 | 6-OCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                 | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1248 | 6-OC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                                 | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1249 | 6-COCH <sub>3</sub>  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1250 | 6-OCOCH <sub>3</sub>   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1251 | 6-OH   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1252 | 6-NH <sub>2</sub>  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1253 | 6-NO <sub>2</sub>  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1254 | 6-CN   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1255 | 6-NHCOCH <sub>3</sub>  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1256 | 6-NHCOC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                              | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1257 | 6-SCH <sub>3</sub>   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1258 | 6-SC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                                 | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |

| No.  | R <sup>1</sup>                                       | R <sup>2</sup>  | R <sup>3</sup>  | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>                | R <sup>6</sup>                | R <sup>7</sup>  | X | Y |
|------|--|-----------------|-----------------|----------------|-------------------------------|-------------------------------|-----------------|---|---|
| 1259 | 6-SCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                 | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1260 | 6-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1261 | 6-SO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>      | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1262 | 6-SO <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1263 | 6-SC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                     | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1264 | 6-SCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>     | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1265 | 6-NHSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1266 | 6-NHSO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1267 | 6-NHSO <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1268 | 6-COOH   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1269 | 6-COOCH <sub>3</sub>                                 | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1270 | 6-COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1271 | 6-COOCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1272 | 6-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1273 | 6-NHCH <sub>3</sub>                                  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1274 | 6-NH(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1275 | 6-CONH <sub>2</sub>                                  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1276 | 6-CONHCH <sub>3</sub>                                | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1277 | 6-CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                 | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1278 | 6-OCONHCH <sub>3</sub>                               | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1279 | 6-OCON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1280 | 6-OCONHCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1281 | 6-OCSNHCH <sub>3</sub>                               | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1282 | 6-OCSN(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1283 | 6-OCSNHCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |
| 1284 | 6-SO <sub>2</sub> NHCH <sub>3</sub>                  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0 |

| No.  | R <sup>1</sup>   | R <sup>2</sup>  | R <sup>3</sup>  | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>                | R <sup>6</sup>                | R <sup>7</sup>  | X | Y              |
|------|--|-----------------|-----------------|----------------|-------------------------------|-------------------------------|-----------------|---|----------------|
| 1285 | 6-SO <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>               | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0              |
| 1286 | 6-SO <sub>2</sub> NHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0              |
| 1287 | 6-SO <sub>2</sub> N(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub> | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0              |
| 1288 | 6-SO <sub>2</sub> NHC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0              |
| 1289 | 6-CF <sub>3</sub>  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | 0              |
| 1290 | 5-Cl   | H               | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1291 | 5-Br   | H               | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1292 | 5-F  | H               | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1293 | 5-CH <sub>3</sub>  | H               | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1294 | 5-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                                  | H               | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1295 | 5-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                | H               | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1296 | 5-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                              | H               | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1297 | 5-CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                  | H               | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1298 | 5-OCH <sub>3</sub>   | H               | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1299 | 5-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                                 | H               | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1300 | 5-OCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                 | H               | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1301 | 5-OC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                                 | H               | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1302 | 5-COCH <sub>3</sub>  | H               | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1303 | 5-OCOCH <sub>3</sub>   | H               | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1304 | 5-OH   | H               | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1305 | 5-NH <sub>2</sub>  | H               | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1306 | 5-NO <sub>2</sub>  | H               | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1307 | 5-CN   | H               | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1308 | 5-NHCOCH <sub>3</sub>  | H               | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1309 | 5-NHCOC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                              | H               | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |

| No.  | R <sup>1</sup>                                       | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>                | R <sup>6</sup>                | R <sup>7</sup>  | X | Y              |
|------|--|----------------|----------------|----------------|-------------------------------|-------------------------------|-----------------|---|----------------|
| 1310 | 5-SCH <sub>3</sub>                                   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1311 | 5-SC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                     | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1312 | 5-SCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                 | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1213 | 5-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                    | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1314 | 5-SO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>      | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1315 | 5-SO <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1316 | 5-SC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                     | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1317 | 5-SCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>     | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1318 | 5-NHSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1319 | 5-NHSO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>    | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1320 | 5-NHSO <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>    | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1321 | 5-COOH   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1322 | 5-COOCH <sub>3</sub>                                 | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1323 | 5-COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1324 | 5-COOCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1325 | 5-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1326 | 5-NHCH <sub>3</sub>                                  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1327 | 5-NH(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>    | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1328 | 5-CONH <sub>2</sub>                                  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1329 | 5-CONHCH <sub>3</sub>                                | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1330 | 5-CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                 | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1331 | 5-CONHCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1332 | 5-OCON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1333 | 5-OCONHCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1334 | 5-OCSNHCH <sub>3</sub>                               | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1335 | 5-OCSN(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |

| No.  | R <sup>1</sup>   | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>                | R <sup>6</sup>                | R <sup>7</sup>  | X | Y              |
|------|--|----------------|----------------|----------------|-------------------------------|-------------------------------|-----------------|---|----------------|
| 1336 | 5-OCSNHCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>             | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1337 | 5-SO <sub>2</sub> NHCH <sub>3</sub>                              | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1338 | 5-SO <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>               | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1339 | 5-SO <sub>2</sub> NHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1340 | 5-SO <sub>2</sub> N(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub> | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1341 | 5-SO <sub>2</sub> NHC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1342 | 5-CF <sub>3</sub>  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1343 | 7-Cl   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1344 | 7-Br   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1345 | 7-F  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1346 | 7-CH <sub>3</sub>  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1347 | 7-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                                  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1348 | 7-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                              | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1349 | 7-CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1350 | 7-OCH <sub>3</sub>   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1351 | 7-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                                 | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1352 | 7-OCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                 | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1353 | 7-OC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                                 | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1354 | 7-COCH <sub>3</sub>  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1355 | 7-OCOCH <sub>3</sub>   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1356 | 7-OH   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1357 | 7-NH <sub>2</sub>  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1358 | 7-NO <sub>2</sub>  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1359 | 7-CN   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1360 | 7-NHCOCH <sub>3</sub>  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |



| No.  | R <sup>1</sup>                                       | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>                | R <sup>6</sup>                | R <sup>7</sup>  | X | Y              |
|------|--|----------------|----------------|----------------|-------------------------------|-------------------------------|-----------------|---|----------------|
| 1361 | 7-NHCOC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1362 | 7-SCH <sub>3</sub>                                   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1363 | 7-SC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                     | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1364 | 7-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>    | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1365 | 7-SCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                 | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1366 | 7-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                    | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1367 | 7-SO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>      | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1368 | 7-SO <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1369 | 7-SC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                     | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1370 | 7-SCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>     | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1371 | 7-NHSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1372 | 7-NHSO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>    | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1373 | 7-NHSO <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>    | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1374 | 7-COOH   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1375 | 7-COOCH <sub>3</sub>                                 | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1376 | 7-COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1377 | 7-COOCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1378 | 7-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1379 | 7-NHCH <sub>3</sub>                                  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1380 | 7-NH(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>    | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1381 | 7-CONH <sub>2</sub>                                  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1382 | 7-CONHCH <sub>3</sub>                                | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1383 | 7-CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                 | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1384 | 7-OCONHCH <sub>3</sub>                               | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1385 | 7-OCON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1386 | 7-OCONHCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |

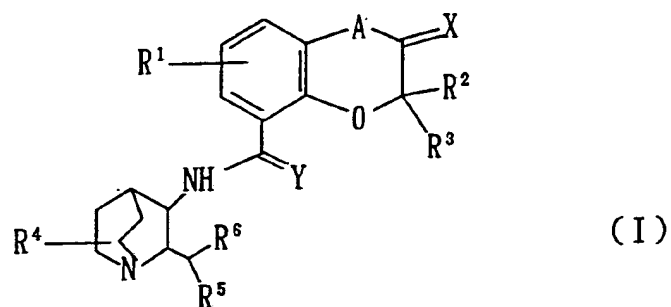
| No.  | R <sup>1</sup>   | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>                | R <sup>6</sup>                | R <sup>7</sup>  | X | Y              |
|------|--|----------------|----------------|----------------|-------------------------------|-------------------------------|-----------------|---|----------------|
| 1387 | 7-OCSNHCH <sub>3</sub>   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | O | H <sub>2</sub> |
| 1388 | 7-OCSN(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                            | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | O | H <sub>2</sub> |
| 1389 | 7-OCSNHCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>             | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | O | H <sub>2</sub> |
| 1390 | 7-SO <sub>2</sub> NHCH <sub>3</sub>                              | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | O | H <sub>2</sub> |
| 1391 | 7-SO <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>               | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | O | H <sub>2</sub> |
| 1392 | 7-SO <sub>2</sub> NHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | O | H <sub>2</sub> |
| 1393 | 7-SO <sub>2</sub> N(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub> | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | O | H <sub>2</sub> |
| 1394 | 7-SO <sub>2</sub> NHC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | O | H <sub>2</sub> |
| 1395 | 7-CF <sub>3</sub>  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | O | H <sub>2</sub> |
| 1396 | 6-Cl   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | O | H <sub>2</sub> |
| 1397 | 6-Br   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | O | H <sub>2</sub> |
| 1398 | 6-F  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | O | H <sub>2</sub> |
| 1399 | 6-CH <sub>3</sub>  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | O | H <sub>2</sub> |
| 1400 | 6-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                                  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | O | H <sub>2</sub> |
| 1401 | 6-SO <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>              | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | O | H <sub>2</sub> |
| 1402 | 6-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                              | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | O | H <sub>2</sub> |
| 1403 | 6-CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | O | H <sub>2</sub> |
| 1404 | 6-OCH <sub>3</sub>   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | O | H <sub>2</sub> |
| 1405 | 6-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                                 | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | O | H <sub>2</sub> |
| 1406 | 6-OCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                 | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | O | H <sub>2</sub> |
| 1407 | 6-OC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                                 | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | O | H <sub>2</sub> |
| 1408 | 6-COCH <sub>3</sub>  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | O | H <sub>2</sub> |
| 1409 | 6-OCOCH <sub>3</sub>   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | O | H <sub>2</sub> |
| 1410 | 6-OH   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | O | H <sub>2</sub> |
| 1411 | 6-NH <sub>2</sub>  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | O | H <sub>2</sub> |

| No.  | R <sup>1</sup>                                      | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>                | R <sup>6</sup>                | R <sup>7</sup>  | X | Y              |
|------|---|----------------|----------------|----------------|-------------------------------|-------------------------------|-----------------|---|----------------|
| 1412 | 6-NO <sub>2</sub>                                   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1413 | 6-CN  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1414 | 6-NHCOCH <sub>3</sub>                               | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1415 | 6-NHCOC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                 | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1416 | 6-SCH <sub>3</sub>                                  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1417 | 6-SC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                    | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1418 | 6-SCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1419 | 6-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1420 | 6-SO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>     | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1421 | 6-SO <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1422 | 6-SC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                    | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1423 | 6-SCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>    | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1424 | 6-NHSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1425 | 6-NHSO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1426 | 6-NHSO <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1427 | 6-COOH  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1428 | 6-COOCH <sub>3</sub>                                | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1429 | 6-COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1430 | 6-COOCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1431 | 6-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                  | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1432 | 6-NHCH <sub>3</sub>                                 | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1433 | 6-NH(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>   | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1434 | 6-CONH <sub>2</sub>                                 | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1435 | 6-CONHCH <sub>3</sub>                               | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1436 | 6-CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1437 | 6-OCONHCH <sub>3</sub>                              | H              | H              | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |

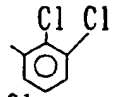
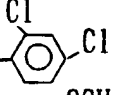
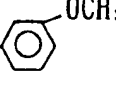
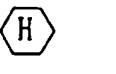
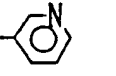
| No.  | R <sup>1</sup>   | R <sup>2</sup>  | R <sup>3</sup>  | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>                | R <sup>6</sup>                | R <sup>7</sup>  | X | Y              |
|------|--|-----------------|-----------------|----------------|-------------------------------|-------------------------------|-----------------|---|----------------|
| 1438 | 6-OCON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                            | H               | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | O | H <sub>2</sub> |
| 1439 | 6-CONHCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>              | H               | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | O | H <sub>2</sub> |
| 1440 | 6-OCSNHCH <sub>3</sub>   | H               | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | O | H <sub>2</sub> |
| 1441 | 6-OCSN(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                            | H               | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | O | H <sub>2</sub> |
| 1442 | 6-OCSNHCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>             | H               | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | O | H <sub>2</sub> |
| 1443 | 6-SO <sub>2</sub> NHCH <sub>3</sub>                              | H               | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | O | H <sub>2</sub> |
| 1444 | 6-SO <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>               | H               | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | O | H <sub>2</sub> |
| 1445 | 6-SO <sub>2</sub> NHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                | H               | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | O | H <sub>2</sub> |
| 1446 | 6-SO <sub>2</sub> N(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub> | H               | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | O | H <sub>2</sub> |
| 1447 | 6-SO <sub>2</sub> NHC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                | H               | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | O | H <sub>2</sub> |
| 1448 | 6-CF <sub>3</sub>  | H               | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | O | H <sub>2</sub> |
| 1449 | 6-Cl   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | O | H <sub>2</sub> |
| 1450 | 6-Br   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | O | H <sub>2</sub> |
| 1451 | 6-F  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | O | H <sub>2</sub> |
| 1452 | 6-CH <sub>3</sub>  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | O | H <sub>2</sub> |
| 1453 | 6-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                                  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | O | H <sub>2</sub> |
| 1454 | 6-SO <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>              | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | O | H <sub>2</sub> |
| 1455 | 6-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                              | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | O | H <sub>2</sub> |
| 1456 | 6-CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | O | H <sub>2</sub> |
| 1457 | 6-OCH <sub>3</sub>   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | O | H <sub>2</sub> |
| 1458 | 6-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                                 | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | O | H <sub>2</sub> |
| 1459 | 6-OCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                 | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | O | H <sub>2</sub> |
| 1460 | 6-OC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                                 | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | O | H <sub>2</sub> |
| 1461 | 6-COCH <sub>3</sub>  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | O | H <sub>2</sub> |
| 1462 | 6-OCOCH <sub>3</sub>   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | O | H <sub>2</sub> |

| No.  | R <sup>1</sup>                                      | R <sup>2</sup>  | R <sup>3</sup>  | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>                | R <sup>6</sup>                | R <sup>7</sup>  | X | Y              |
|------|---|-----------------|-----------------|----------------|-------------------------------|-------------------------------|-----------------|---|----------------|
| 1463 | 6-OH  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1464 | 6-NH <sub>2</sub>                                   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1465 | 6-NO <sub>2</sub>                                   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1466 | 6-CN  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1467 | 6-NHCOCH <sub>3</sub>                               | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1468 | 6-NHCOC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                 | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1469 | 6-SCH <sub>3</sub>                                  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1470 | 6-SC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1471 | 6-SCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1472 | 6-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1473 | 6-SO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>     | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1474 | 6-SO <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1475 | 6-SC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1476 | 6-SCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1477 | 6-NHSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1478 | 6-NHSO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1479 | 6-NHSO <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1480 | 6-COOH  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1481 | 6-COOCH <sub>3</sub>                                | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1482 | 6-COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1483 | 6-COOCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1484 | 6-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1485 | 6-NHCH <sub>3</sub>                                 | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1486 | 6-NH(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1487 | 6-CONH <sub>2</sub>                                 | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1488 | 6-CONHCH <sub>3</sub>                               | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |

| No.  | R <sup>1</sup>   | R <sup>2</sup>  | R <sup>3</sup>  | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>                | R <sup>6</sup>                | R <sup>7</sup>  | X | Y              |
|------|--|-----------------|-----------------|----------------|-------------------------------|-------------------------------|-----------------|---|----------------|
| 1489 | 6-CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                             | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1490 | 6-CONHCH <sub>3</sub>  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1491 | 6-OCN(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                             | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1492 | 6-OCNHCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>              | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1493 | 6-OCSNHCH <sub>3</sub>   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1494 | 6-OCSN(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                            | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1495 | 6-OCSNHCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>             | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1496 | 6-SO <sub>2</sub> NHCH <sub>3</sub>                              | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1497 | 6-SO <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>               | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1498 | 6-SO <sub>2</sub> NHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1499 | 6-SO <sub>2</sub> N(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub> | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1500 | 6-SO <sub>2</sub> NHC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |
| 1501 | 6-CF <sub>3</sub>  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>3</sub> | 0 | H <sub>2</sub> |

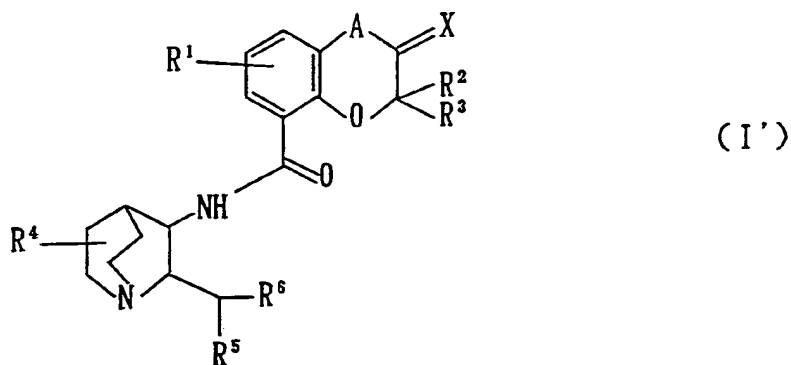


| No.  | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup>  | R <sup>3</sup>  | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>                | R <sup>6</sup>                | A                 | X              | Y              |
|------|----------------|-----------------|-----------------|----------------|-------------------------------|-------------------------------|-------------------|----------------|----------------|
| 1502 | H              | H               | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | CH <sub>2</sub>   | H <sub>2</sub> | O              |
| 1503 | H              | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | O                 | H <sub>2</sub> | O              |
| 1504 | H              | H               | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | S                 | H <sub>2</sub> | O              |
| 1505 | H              | H               | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | N-CH <sub>3</sub> | O              | O              |
| 1506 | H              | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> |                               | —                 | H <sub>2</sub> | O              |
| 1507 | H              | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> |                               | —                 | H <sub>2</sub> | O              |
| 1508 | H              | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> |                               | —                 | H <sub>2</sub> | O              |
| 1509 | H              | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> |                               | —                 | H <sub>2</sub> | O              |
| 1510 | H              | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> |                               | —                 | H <sub>2</sub> | O              |
| 1511 | H              | H               | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> |                               | CH <sub>2</sub>   | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 1512 | H              | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> |                               | O                 | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 1513 | H              | H               | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> |                               | S                 | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 1514 | H              | H               | H               | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> |                               | N-CH <sub>3</sub> | O              | H <sub>2</sub> |

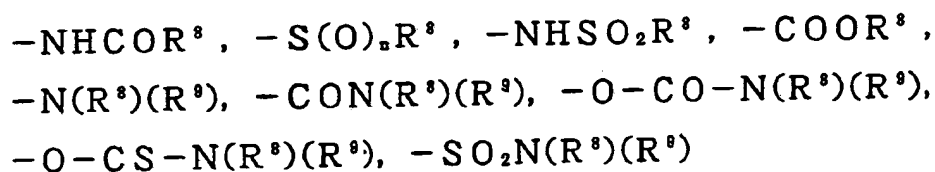
| No.  | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup>  | R <sup>3</sup>  | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>                | R <sup>6</sup>  | A | X              | Y              |
|------|----------------|-----------------|-----------------|----------------|-------------------------------|---|---|----------------|----------------|
| 1515 | H              | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> |  | — | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 1516 | H              | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> |  | — | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 1517 | H              | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> |  | — | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 1518 | H              | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> |  | — | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |
| 1519 | H              | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> |  | — | H <sub>2</sub> | H <sub>2</sub> |



また、本発明は、一般式 (I')



(式中、Aはメチレン基、酸素原子、硫黄原子、 $-N(R^7)-$ で表される基(式中、 $R^7$ は水素、炭素数1~6個のアルキルまたはアラルキルを示す。)または直接結合を示す。Xは酸素原子、硫黄原子または水素2原子を示す。 $R^1$ は水素、ハロゲン、炭素数1~6個のアルキル、ハロアルキル、アラルキル、炭素数1~6個のアルコキシ、アラルキルオキシ、アリアルコキシ、アシル、アシルオキシ、ヒドロキシ、アミノ、ニトロ、シアノまたは式



(式中、 $R^8$ ,  $R^8$ は同一または異なってそれぞれ水素、炭素数1~6個のアルキル、フェニルまたはアラルキルを示し、 $n$ は0, 1または2を示す。)から選ばれる基を示す。 $R^2$ ,  $R^3$ は同一または異なって水素または炭素数1~6個のアルキルを示す。 $R^4$ は水素または炭素数1~6個のアルキルを示す。 $R^5$ はチエニルまたはフェニルを示す。 $R^6$ は炭素数1~6個のアルキル、炭素数2~6個のアルケニル、炭素数3~7個のシクロアルキル、フリル、チエニル、ピリジル、インドリル、ビフェニルまたはフェニルを示す。]

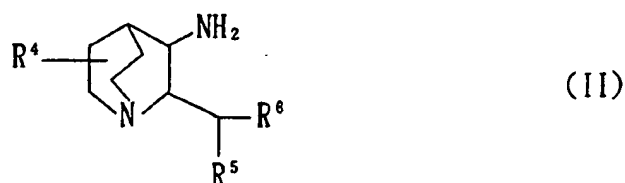
により表されるキヌクリジン化合物またはその医薬上許容されうる酸付加塩も提供する。

一般式 (I')で表される化合物(以下、化合物 (I')という)は、一般式 (I)においてYが水素2原子で飽和された化合物の合成中間体としても有用である。

本発明化合物は、以下に示す方法によって製造することができる。

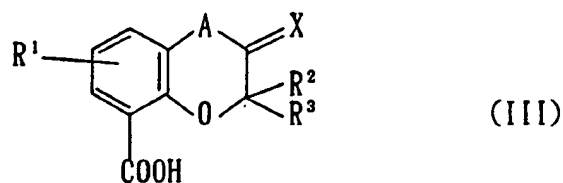
### 方法 1

一般式 (I) において Y が酸素原子である化合物は、米国特許第 3, 560, 510 号明細書またはジャーナル・オブ・メディシナル・ケミストリー (Journal of Medicinal Chemistry) 第 10 巻、No 6、587 頁に記載の方法に準じて合成される一般式 (II)



(式中、各記号は前記と同義である。)

により表される化合物 (以下、化合物 (II) という) と、米国特許第 4, 892, 872 号明細書またはヨーロッパ公開特許第 407137 号公報に記載の方法に準じて合成される一般式 (III)



(式中、各記号は前記と同義である。)

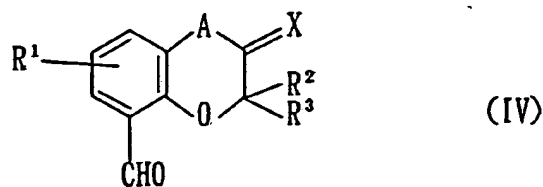
により表されるカルボン酸またはその反応性誘導体とを縮合させることにより得られる。

化合物 (II) と一般式 (III) で表される化合物 (以下、化合物 (III) という) との縮合反応は、それ自体公知のアミド化法あるいはペプチド合成法などが準用できる。たとえば化合物 (III) が遊離のカルボン酸の場合、そのアミド化反応は、ジシクロヘキシルカルボジイミド、ハロゲン化リン (三塩化リン、オキシ塩化リンなど)、ジフェニルホスホリルアジド、2-クロロ-N-メチルピリジニウムヨーダイドトリブチルアミン系 (向山法) などの縮合剤の存在下に、不活性溶

媒中あるいは無溶媒で、冷却下または室温ないし加温下に行われる。一般式 (III) で表されるカルボン酸の反応性誘導体が酸ハライド（酸クロリド、酸ブロミドなど）あるいは混合酸無水物（低級アルキル炭酸混合酸無水物、アルキルリン酸混合酸無水物など）の場合、その反応は、不活性溶媒中あるいは無溶媒で、好ましくはトリエチルアミン、N-メチルモルホリン、ピリジン、ジメチルアニリンなどの有機塩基、あるいは炭酸水素アルカリ、炭酸アルカリ、水酸化アルカリなどの無機塩基の脱酸剤の存在下に冷却下から加温下に行われる。さらに、反応性誘導体として低級アルキルエステル（メチルエステル、エチルエステルなど）、あるいはいわゆる活性エステル（p-ニトロフェニルエステル、p-クロロベンジルエステル、p-クロロフェニルエステル、コハク酸イミドエステル、ベンゾトリアゾールエステルなど）を用いる場合、反応は不活性溶媒中あるいは無溶媒で室温から加温下によって行われる。以上に述べたアミド化反応に用いられる不活性溶媒としてはヘキサン、ベンゼン、トルエンなどの炭化水素類、クロロホルム、ジクロロメタン、ジクロロエタンなどのハロゲン化炭化水素類、テトラヒドロフラン、ジオキサンなどのエーテル類、酢酸エチルなどのエステル類、アセトンなどのケトン類、メタノール、エタノール、イソプロピルアルコールなどのアルコール類、ジメチルホルムアミドなどのアミド類、アセトニトリル、ジメチルスルホキシド、水など、またはその混合溶媒があげられ、反応に応じて適宜選択することができる。

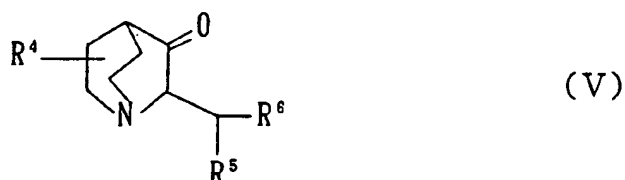
## 方法2

一般式 (I) においてYが水素で飽和された化合物は、化合物 (II) と米国特許第4,892,872号明細書またはヨーロッパ公開特許第407137号公報に記載の方法に準じて合成される一般式 (IV)



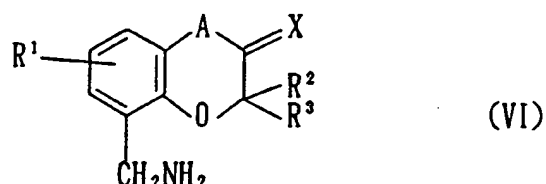
(式中、各記号は前記と同義である。)

により表される化合物（以下、化合物（IV）という）とを還元的縮合反応に付すか；米国特許第 3, 5 0 6, 6 7 3 号明細書に記載の方法に準じて合成される一般式（V）



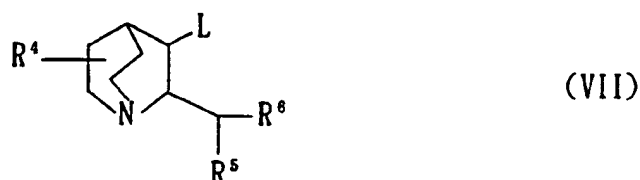
（式中、各記号は前記と同義である。）

により表される化合物（以下、化合物（V）という）と一般式(VI)



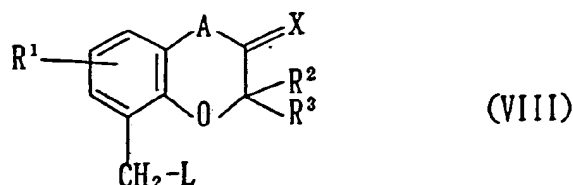
（式中、各記号は前記と同義である。）

により表される化合物（以下、化合物（VI）という）とを還元的縮合反応に付すか；化合物（VI）と一般式(VII)



〔式中、Lは反応活性な脱離基（有機合成化学上よく知られる脱離基を示し、たとえば塩素、臭素、沃素、フッ素などのハロゲン、メタンスルホニルオキシ、トリフルオロメタンスルホニルオキシ、p-トルエンスルホニルオキシ、ニトロベンゼンスルホニルオキシなどのスルホン酸エステル基など）を示し、他の各記号は前記と同義である。〕

により表される化合物（以下、化合物（VII）という）を縮合反応に付すか；または化合物（II）と一般式(VIII)



(式中、各記号は前記と同義である。)

により表される化合物（以下、化合物(VIII)という）とを縮合させることによって製造することができる。

化合物(II)と化合物(IV)との還元的縮合反応、および化合物(V)と化合物(VI)との還元的縮合反応は、本反応を阻害しない適当な溶媒中、還元剤の存在下に行われるか、または、触媒量の脱水剤の存在下あらかじめ相当するイミン(シッフの塩基)に誘導した後、続いて還元剤を添加することにより行われる。溶媒としては前述した溶媒を用いることができる。還元条件としては、白金、パラジウム、ラネーニッケル、ロジウムなどの金属やそれらの担体との混合物を触媒とする接触的水素還元；または水素化リチウムアルミニウム、水素化シアノホウ素ナトリウム、水素化ホウ素ナトリウム、水素化ホウ素カリウムなどの水素化金属類による還元；金属ナトリウム、金属マグネシウムなどとメタノール、エタノールなどのアルコールによる還元；鉄、亜鉛などの金属と塩酸、酢酸などの酸による還元などの反応条件を挙げることができる。特に、水素化シアノホウ素ナトリウムなどの水素化金属類による還元の場合、好ましくは塩酸または酢酸などの酸の存在下を実施するのが望ましい。必要に応じて用いられる脱水縮合剤としては特に限定はなく、無機酸（塩酸、硫酸、硝酸など）、有機酸（メタンスルホン酸、p-トルエンスルホン酸など）、ルイス酸（塩化アルミニウム、四塩化錫、塩化鉄、トリフルオロボランエテラート、ジブチル錫ジクロリドなど）、モレキュラーシーブなどが挙げられる。還元的縮合反応の温度は用いられる溶媒により異なるが、一般には $-20^{\circ}\text{C}$ ～ $100^{\circ}\text{C}$ が好ましい。また、本反応は常圧で十分目的を達成できるが、場合によっては加圧あるいは減圧下に行ってもよい。

化合物(VI)と化合物(VII)との縮合反応、および化合物(II)と化合物(VIII)

との縮合反応は、塩基の存在下または非存在下に、本反応を阻害しない溶媒（ヘキサン、ベンゼン、トルエンなどの炭化水素類、クロロホルム、ジクロロメタンなどのハロゲン化炭化水素類、酢酸エチルなどのエステル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミドなどのアミド類、アセトニトリル、ジメチルスルホキシドなど）中、または無溶媒で行われる。必要に応じて用いられる塩基としては特に限定はなく、好ましくは炭酸ナトリウム、炭酸カリウムなどのアルカリ炭酸金属塩、炭酸水素ナトリウムなどのアルカリ炭酸水素金属塩、水素化ナトリウム、水素化リチウムなどの水素化アルカリ金属、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウム第三ブトキシドなどのアルカリ金属アルコキシド、トリエチルアミン、ピリジンなどの有機塩基が挙げられる。また、テトラ- $n$ -ブチルアンモニウムブロマイド、ベンジルトリエチルアンモニウムヨーダイドなどの相間移動触媒を用い、水とその他の有機溶媒との混合溶媒中で反応を行う場合には、水酸化ナトリウム、水酸化カリウムなどの水酸化アルカリ金属を用いることもできる。反応は通常  $0^{\circ}\text{C} \sim 150^{\circ}\text{C}$  で行われる。

なお、化合物 (VI) は一般式 (III) で表されるカルボン酸誘導体をアミド体へと導き、有機化学上公知の方法に準じて還元することによって容易に合成することができる。

また、化合物 (VIII) は、たとえば一般式 (III) で表されるカルボン酸またはそのエステル体を有機化学上公知の方法により還元してアルコール体へと導き、さらにその水酸基をハロゲン化することなどにより、容易に合成される。

### 方法 3

一般式 (I) において Y が水素で飽和された化合物は、化合物 (I') を還元反応に付すことによっても製造することができる。

還元反応は反応を阻害しない溶媒中、冷却下ないし加温下において行われる。還元剤としては水素化リチウムアルミニウム、水素化アルミニウム、トリメトキシ水素化リチウムアルミニウム、メトキシエトキシアルミニウムハイドライド、ナトリウムビス- (2-メトキシエトキシ) アルミニウムハイドライド、ボランなどの無機水素化物などが挙げられる。

## 方法 4

一般式 (I) において Y が硫黄原子である化合物は、化合物 (I') をチオン化試薬を用いて直接チオン化することによって製造される。

チオン化試薬としては五硫化リン、Lawesson 試薬〔2, 4-ビス(4-メトキシフェニル)-1, 3, 2, 4-ジチアジホスフェタン-2, 4-ジスルフィド〕、硫化水素などが挙げられ、反応は、通常反応に不活性な溶媒(ピリジン、ジメチルアニリン、ベンゼン、トルエン、キシレン、テトラヒドロフラン、クロロホルム、ジオキサンなど、またはその混合溶媒)中、30℃～100℃で30分から5時間で進行する。

以上のようにして得られる反応生成物は再結晶法、カラムクロマトグラフィーなどの有機合成化学上よく知られた方法により、容易に精製することができる。なお、所望の絶対配置を有する立体異性体は光学活性な原料を用いて合成するか、あるいはラセミ体の反応生成物を適当な光学分割試薬を用いることにより、製造することができる。

また、このようにして得られた本発明の化合物 (I) のいくつかは、常法により無機酸または有機酸と処理することによって前記に示した酸付加塩とすることができる。

本発明の化合物 (I)、その異性体および医薬上許容されうる塩は、P 物質の拮抗作用を有することから、無痛覚症、炎症、喘息、アレルギー、中枢神経系疾患、循環器系疾患、消化器系疾患などの諸症状において治療学的応用を見出すことができ、痛み(片頭痛など)、炎症、呼吸器系疾患(咳、喀痰などを伴う慢性気管支炎、喘息、鼻炎など)、中枢神経系疾患(不安症、精神病など)、循環器系疾患(高血圧症、心不全など)、消化器系疾患(過敏性大腸炎、潰瘍性大腸炎、クローン病など)の治療薬として有用である。具体的には、鎮痛抗炎症薬、鎮咳去痰剤、抗喘息薬、抗不安薬、降圧剤、抗潰瘍剤などとして用いられる。

以下に薬理実験例を示す。

## 実験例 1 : P 物質受容体結合試験

モレキュラーファーマコロジー (Molecular Pharmacology) 23 巻、563～

569頁(1983年)に報告されたりー(Le)CMらの方法に従って本発明化合物のP物質拮抗作用を検討した。すなわち、雄ウィスターラットから下顎腺を取り出し、体積10倍の氷冷50mMトリス塩酸緩衝液(pH7.4)においてホモジナイズした。このホモジネートを300mMの塩化カリウムと10mMのEDTA存在下、氷冷にてインキュベートし、50,000×Gで遠心分離にかけた。こうして得られたペレットを体積20倍の氷冷50mMトリス塩酸緩衝液(pH7.4)に懸濁し、再度遠心分離し、得られたペレットを体積60倍のトリス塩酸緩衝液に懸濁して組織標本を作成した。

受容体結合試験は、上述の組織標本400 $\mu$ lに50mMトリス塩酸緩衝液(pH7.4)、0.02%ウシ血清アルブミン、1 $\mu$ gのキモスタチン、2 $\mu$ gのロイペプチン、20 $\mu$ gのバシトラシンならびに被験化合物を含む1.2nMの放射性リガンド([<sup>3</sup>H]-サブスタンスP)を添加し最終体積を500 $\mu$ lとした。次に20℃で10分間反応させた後、反応液に5mlのトリス塩酸緩衝液を加えすばやく吸引濾過し、フィルターを氷冷したトリス塩酸緩衝液2mlで2回洗浄した。フィルター上の放射能活性は液体シンチレーションカウンターで測定し、一般的な統計的手法により50%阻害濃度IC<sub>50</sub>値を求めた。特異的結合は、1 $\mu$ MのP物質の存在下で試験して得られる非特異的結合を全体の結合から引くことにより求めた。その結果を次の表に示す。



| 化合物         | IC <sub>50</sub> (nM) |
|-------------|-----------------------|
| 実施例 6 の化合物  | 5.4                   |
| 実施例 7 の化合物  | 13                    |
| 実施例 17 の化合物 | 1.1                   |
| 対照化合物       | 23                    |

対照化合物はWO 90/05729号にて公開された(±)- $\alpha$ -[3-(2-メトキシフェニル)メチルアミノ]-2-ベンズヒドリルキヌクリジンである。

#### 実験例 2 : P 物質誘発気道収縮に対する化合物の拮抗作用

ハートレイ (Hartley) 系雌性モルモットをペントバルビタール (30 mg/kg) の腹腔内投与により麻酔し、気管と頸動脈のカニュレーションを行った。人工呼吸下 (50 strokes/分) で P 物質  $10^{-8}$  mol/kg の静脈投与による気道抵抗をコンツェット (Konzett) とロスラー (Rossler) の方法 [アルシーフ・フュア・エクスペリメンテレ・パトロジー・ウント・ファルマコロジー (Arch. Exp. Pathol. Pharmacol.) 195 巻、71-74 頁 (1940 年)] を修正して測定した。10 分間隔で P 物質を投与した。収縮が安定したところで、次の P 物質投与 3 分前に被験化合物を静脈投与し、その抑制率から 50% 有効量 (ED<sub>50</sub>, mg/kg) を計算した。その結果を次の表に示す。

| 化合物       | ED <sub>50</sub> (mg/kg) |
|-----------|--------------------------|
| 実施例7の化合物  | 0.083                    |
| 実施例17の化合物 | 0.031                    |
| 対照化合物     | 0.11                     |

(対照化合物は実験例1のものと同一である。)

#### 実験例3：急性毒性

雄性ddYマウスを一群10匹として用い、実施例17の化合物3mg/kgを静脈内投与したところ、投与後5日間まで死亡例は認められなかった。

本発明の化合物(I)を前述の医薬として用いる場合、それ自体あるいは適宜、薬理学的に許容される担体、賦形剤、希釈剤などと混合し、散剤、顆粒剤、錠剤、カプセル剤、注射剤などの形態で経口的または非経口的に投与することができる。投与量は対象疾患、症状、あるいは用いる化合物により異なるが、経口投与の場合、通常、成人1日当たり1～100mg程度である。

以下に、実施例を挙げて本発明を具体的に説明するが、本発明はこれらに限定されるものではない。

#### 実施例 1

公知の方法にて得られる 6-クロロ-3, 4-ジヒドロ-4-メチル-2H-1, 4-ベンズオキサジン-8-カルボン酸 4.83 g とトリエチルアミン 7.0 ml のテトラヒドロフラン溶液 70 ml を -5°C に冷却する。この溶液に温度を -5°C に保ちながら塩化ピバロイル 3.1 ml を滴下する。同温で 15 分間攪拌後、公知の方法により製造されたシス-3-アミノ-2-ベンズヒドリルキヌクリジン 5.84 g の塩化メチレン溶液を滴下する。反応混合物を 1 時間攪拌後、減圧濃縮し塩化メチレンと 1 規定水酸化ナトリウム溶液に分配させる。有機層を食塩水で洗浄後、硫酸マグネシウムで乾燥する。濃縮し、イソプロピルアルコールより結晶化し、この結晶をメタノールにより再結晶することにより、シス-N-[3-(2-ベンズヒドリルキヌクリジニル)]-6-クロロ-3, 4-ジヒドロ-4-メチル-2H-1, 4-ベンズオキサジン-8-カルボキサミド 2.2 g を得る。融点 240~241°C

NMR (CDCl<sub>3</sub>, 100 MHz) :

1.20-2.10 (5H), 2.70-2.90 (4H), 2.94 (3H, s), 3.44 (2H, m),  
4.04 (2H, m), 4.51 (2H, m), 6.62 (1H, d, J=3Hz), 6.90-7.24 (11H),  
8.01 (1H, d, J=10Hz)

元素分析: C<sub>30</sub>H<sub>34</sub>ClN<sub>3</sub>O として

計算値: C 71.77, H 6.42, N 8.37

実測値: C 71.57, H 6.49, N 8.33

#### 実施例 2

2, 2-ジメチル-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-7-カルボン酸 2.3 g と塩化ピバロイル 1.46 ml、トリエチルアミン 3.36 ml、シス-3-アミノ-2-ベンズヒドリルキヌクリジン 2.92 g を用いて実施例 1 と同じ製造法に付することにより、シス-N-[3-(2-ベンズヒドリルキヌクリジニル)]-2, 2-ジメチル-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-7-カルボキサミド 1.

2 gを得る。融点 254～255℃

NMR (CDCl<sub>3</sub>, 100 MHz) :

1.60 (3H, s), 1.84 (3H, s), 2.60-3.05 (4H), 3.13 (2H, s),  
3.94 (1H, dd, J=8Hz, 10Hz), 4.18 (1H, d, J=10Hz), 4.44 (1H, m),  
6.70-7.25 (12H), 7.54 (1H, m), 8.12 (1H, d, J=8Hz)

元素分析: C<sub>31</sub>H<sub>34</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub> として

計算値: C 79.79, H 7.34, N 6.00

実測値: C 79.67, H 7.49, N 6.03

### 実施例 3

2, 2-ジメチル-5-メチルチオ-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-7-カルボン酸 2.9 g と塩化ピバロイル 1.46 ml、トリエチルアミン 3.36 ml、シス-3-アミノ-2-ベンズヒドリルキヌクリジン 2.92 g を用いて実施例 1 と同じ製造法に付することにより、シス-N-[3-(2-ベンズヒドリルキヌクリジニル)]-2, 2-ジメチル-5-メチルチオ-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-7-カルボキサミド 1.2 g を得る。融点 218～220℃

NMR (CDCl<sub>3</sub>, 100 MHz) :

1.60 (3H, s), 1.85 (3H, s), 1.10-2.10 (11H), 2.44 (3H, s),  
2.64-3.04 (4H), 3.12 (2H), 3.80-4.26 (2H), 4.44 (1H, m),  
6.90-7.24 (12H), 7.48-7.56 (1H), 8.08 (1H, d, J=8Hz)

元素分析: C<sub>32</sub>H<sub>36</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S として

計算値: C 74.96, H 7.08, N 5.46

実測値: C 74.90, H 7.08, N 5.43

### 実施例 4

2, 2-ジメチル-5-ニトロ-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-7-カルボン酸 2.9 g と塩化ピバロイル 1.46 ml、トリエチルアミン 3.36 ml、シス-3-アミノ-2-ベンズヒドリルキヌクリジン 2.92 g を用いて実施例 1 と同じ製造法に付することにより、シス-N-[3-(2-ベンズヒドリルキヌクリジニル)]-2, 2-ジメチル-5-ニトロ-2, 3-ジヒドロベンゾフ

ラン-7-カルボキサミド1. 2 gを得る。融点258~260°C

NMR (CDCl<sub>3</sub>, 100 MHz) :

1.60 (3H, s), 1.85 (3H, s), 1.10-2.10 (11H), 2.68-3.16 (4H),  
3.24 (2H, s), 4.03 (1H, dd, J=7Hz, 12Hz), 4.14 (1H, d, J=12Hz),  
4.50 (1H, m), 6.84-7.28 (10H), 8.08 (1H, m), 8.49 (1H, J=2Hz)

元素分析: C<sub>31</sub>H<sub>33</sub>N<sub>3</sub>O<sub>4</sub> として

計算値: C 72.78, H 6.50, N 8.21

実測値: C 72.65, H 6.47, N 8.17

#### 実施例 5

シス-N-〔3-(2-ベンズヒドリルキヌクリジニル)〕-2, 2-ジメチル-5-ニトロ-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-7-カルボキサミド1. 8 gを窒素気流下、1モル濃度のボランのテトラヒドロフラン溶液20 mlに溶解し、5時間還流する。反応液を濃縮後、5%塩酸30 mlにて2時間還流を行い、冷却して水酸化ナトリウムよりアルカリ性とする。析出する物質をジクロロメタンで抽出後、有機層を硫酸マグネシウムで乾燥濃縮する。得られる残渣をエタノールから結晶化することにより、シス-3-〔(2, 2-ジメチル-5-ニトロ-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-7-イル)メチル〕アミノ-2-ベンズヒドリルキヌクリジン0.52 gを得る。融点194~195°C

NMR (CDCl<sub>3</sub>, 100 MHz) :

1.44 (3H, s), 1.48 (3H, s), 1.04-2.12 (11H), 2.45-2.90 (4H),  
3.00 (2H, s), 3.05-3.40 (3H), 3.67 (1H, dd, J=8Hz, 12Hz),  
4.42 (1H, d, J=12Hz), 6.90-7.36 (11H), 7.82 (1H, m)

元素分析: C<sub>31</sub>H<sub>35</sub>N<sub>3</sub>O<sub>4</sub> として

計算値: C 74.82, H 7.09, N 8.45

実測値: C 74.88, H 7.17, N 8.46

#### 実施例 6

シス-N-〔3-(2-ベンズヒドリルキヌクリジニル)〕-2, 2-ジメチル-5-メチルチオ-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-7-カルボキサミド1.

9 g と 1 モル濃度のボランのテトラヒドロフラン溶液 20 ml を実施例 5 と同様の製造法に付すことにより、シス-3-[(2, 2-ジメチル-5-メチルチオ-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-7-イル) メチル] アミノ-2-ベンズヒドリルキヌクリジン 0.85 g を得る。融点 136~138℃

NMR (CDCl<sub>3</sub>, 100 MHz) :

1.37 (3H, s), 1.43 (3H, s), 1.10-2.10 (11H), 2.38 (3H, s),  
2.45-2.90 (4H), 2.84 (2H, s), 3.00-3.40 (3H),  
3.66 (1H, dd, J=8Hz, 12Hz), 4.46 (1H, d, J=12Hz),  
6.24 (1H, d, J=2Hz), 6.92 (1H, d, J=1Hz), 7.00-7.38 (11H)

元素分析: C<sub>32</sub>H<sub>33</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S として

計算値: C 77.07, H 7.68, N 5.62

実測値: C 76.82, H 7.64, N 5.61

#### 実施例 7

シス-N-[3-(2-ベンズヒドリルキヌクリジニル)]-2, 2-ジメチル-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-7-カルボキサミド 2.5 g と 1 モル濃度のボランのテトラヒドロフラン溶液 27 ml を実施例 5 と同様の製造法に付すことにより、シス-3-[(2, 2-ジメチル-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-7-イル) メチル] アミノ-2-ベンズヒドリルキヌクリジン 1.50 g を得る。

融点 164~165℃

NMR (CDCl<sub>3</sub>, 100 MHz) :

1.37 (3H, s), 1.44 (3H, s), 1.10-2.20 (11H), 2.44-2.90 (4H),  
2.93 (2H, s), 3.00-3.42 (3H), 3.66 (1H, dd, J=8Hz, 12Hz),  
4.46 (1H, d, J=12Hz), 5.98 (1H, d, J=8Hz), 6.52 (1H, dd, J=8Hz, 8Hz),  
6.80-7.40 (11H)

#### 実施例 8

シス-N-[3-(2-ベンズヒドリルキヌクリジニル)]-6-クロロ-3, 4-ジヒドロ-4-メチル-2H-1, 4-ベンズオキサジン-8-カルボキサミド 1.0 g と 1 モル濃度のボランのテトラヒドロフラン溶液 10 ml を実施例

5と同様の製造法に付すことにより、シス-3-〔(6-クロロ-3, 4-ジヒドロ-4-メチル-2H-1, 4-ベンズオキサジン-8-イル)メチル〕アミノ-2-ベンズヒドリルキヌクリジン0.36gを得る。融点181~183℃  
NMR (CDCl<sub>3</sub>, 100MHz) :

1.04-2.12 (7H), 2.44-2.90 (5H), 2.80 (3H, s), 3.00-3.20 (2H),  
3.20-3.41 (2H), 3.66 (1H, dd, J=8Hz, 12Hz), 3.99 (2H, dd, J=5Hz, 6Hz),  
4.47 (1H, d, J=12Hz), 5.89 (1H, d, J=3Hz), 6.41 (1H, d, J=3Hz),  
7.00-7.40 (10H)

#### 実施例 9

6-クロロ-2, 2-ジメチル-3, 4-ジヒドロ-4-メチル-2H-1, 4-ベンズオキサジン-8-カルボン酸2.81gと塩化ピバロイル1.34ml、トリエチルアミン1.54ml、シス-3-アミノ-2-ベンズヒドリルキヌクリジン2.92gを用いて実施例1と同じ製造法に付することにより、シス-N-〔3-(2-ベンズヒドリルキヌクリジニル)〕-6-クロロ-2, 2-ジメチル-3, 4-ジヒドロ-4-メチル-2H-1, 4-ベンズオキサジン-8-カルボキサミド2.2gを得る。融点254~256℃

NMR (CDCl<sub>3</sub>, 100MHz) :

1.20-2.10 (5H), 1.48 (3H, s), 1.73 (3H, s), 2.64-3.00 (4H),  
2.98 (3H, s), 3.16 (2H, m), 4.06 (2H, m), 4.50 (2H, m),  
6.66 (1H, d, J=2Hz), 6.90-7.30 (11H), 8.21 (1H, d, J=10Hz)

元素分析: C<sub>32</sub>H<sub>37</sub>ClN<sub>3</sub>O<sub>2</sub> として

計算値: C 72.37, H 7.02, N 7.91

実測値: C 72.06, H 7.11, N 7.83

#### 実施例 10

5-メチルチオ-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-7-カルボン酸0.84gと塩化ピバロイル0.48ml、トリエチルアミン0.56ml、シス-3-アミノ-2-ベンズヒドリルキヌクリジン1.18gを用いて実施例1と同じ製造法に付することにより、シス-N-〔3-(2-ベンズヒドリルキヌクリジニル)〕

ー5ーメチルチオー2, 3ージヒドロベンゾフランー7ーカルボキサミド1. 14 gを得る。融点200~201℃

NMR (CDCl<sub>3</sub>, 100 MHz) :

1.25-2.10 (5H), 2.45 (3H, s), 2.70-3.12 (4H), 3.32 (2H, t, J=8Hz),  
3.80-4.28 (2H), 4.50 (1H, m), 4.88 (2H, m), 6.80-7.30 (11H),  
7.52 (1H, d, J=2Hz), 7.90 (1H, d, J=10Hz)

元素分析: C<sub>30</sub>H<sub>32</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>Sとして

計算値: C 74.35, H 6.66, N 5.78

実測値: C 73.78, H 6.83, N 5.68

#### 実施例 1 1

5ーベンジルチオー2, 3ージヒドロベンゾフランー7ーカルボン酸0. 94 gと塩化ピバロイル0. 40 ml、トリエチルアミン0. 46 ml、シスー3ーアミノー2ーベンズヒドリルキヌクリジン0. 88 gを用いて実施例1と同じ製造法に付することにより、シスーNー〔3ー(2ーベンズヒドリルキヌクリジニル)〕ー5ーベンジルチオー2, 3ージヒドロベンゾフランー7ーカルボキサミド1. 14 gを得る。融点184~185℃

NMR (CDCl<sub>3</sub>, 100 MHz) :

1.25-2.10 (5H), 2.70-3.12 (4H), 3.90-4.24 (2H), 4.48 (1H, m),  
4.88 (2H, m), 6.80-7.30 (16H), 7.66 (1H, d, J=2Hz),  
7.86 (1H, d, J=10Hz)

#### 実施例 1 2

5ーイソプロピルチオー2, 3ージヒドロベンゾフランー7ーカルボン酸0. 57 gと塩化ピバロイル0. 30 ml、トリエチルアミン0. 70 ml、シスー3ーアミノー2ーベンズヒドリルキヌクリジン0. 69 gを用いて実施例1と同じ製造法に付することにより、シスーNー〔3ー(2ーベンズヒドリルキヌクリジニル)〕ー5ーイソプロピルチオー2, 3ージヒドロベンゾフランー7ーカルボキサミド0. 90 gを得る。融点176~177℃

NMR (CDCl<sub>3</sub>, 100 MHz) :



1.24 (6H, d, J=8Hz), 1.40-2.10 (5H), 2.70-3.44 (6H), 4.08 (2H, m),  
 4.50 (1H, m), 4.89 (2H, m), 6.80-7.38 (11H), 7.66 (1H, d, J=2Hz),  
 7.87 (1H, d, J=10Hz)

元素分析:  $C_{32}H_{36}N_2O_2S$ として

計算値: C 74.96, H 7.08, N 5.46

実測値: C 75.07, H 7.16, N 5.45

### 実施例 13

2, 2-ジメチル-5-メタンスルホニル-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-7-カルボン酸 1.35 g とクロロ炭酸エチル 0.61 ml、トリエチルアミン 1.4 ml、シス-3-アミノ-2-ベンズヒドリルキヌクリジン 1.39 g を用いて実施例 1 と同じ製造法に付することにより、シス-N-〔3-(2-ベンズヒドリルキヌクリジニル)〕-2, 2-ジメチル-5-メタンスルホニル-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-7-カルボキサミド 1.67 g を得る。融点 249 ~ 250 °C

NMR (CDCl<sub>3</sub>, 100 MHz) :

1.66 (3H, s), 1.90 (3H, s), 1.40-2.10 (5H), 2.70-3.10 (4H),  
 3.00 (3H, s), 3.23 (2H, m), 3.86-4.24 (2H), 4.50 (1H, m),  
 6.80-7.38 (11H), 7.66 (1H, d, J=2Hz), 7.87 (1H, d, J=10Hz)

元素分析:  $C_{32}H_{36}N_2O_2S$ として

計算値: C 74.96, H 7.08, N 5.46

実測値: C 75.07, H 7.16, N 5.45

### 実施例 14

5-メタンスルホニル-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-7-カルボン酸 1.0 g とクロロ炭酸エチル 0.54 ml、トリエチルアミン 1.2 ml、シス-3-アミノ-2-ベンズヒドリルキヌクリジン 1.17 g を用いて実施例 1 と同じ製造法に付することにより、シス-N-〔3-(2-ベンズヒドリルキヌクリジニル)〕-5-メタンスルホニル-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-7-カルボキサミド 1.65 g を得る。融点 266 ~ 267 °C

NMR (CDCl<sub>3</sub>, 100 MHz) :

1.30-2.10 (5H), 2.60-3.10 (4H), 3.00 (3H, s), 3.40 (2H, m),  
3.86-4.14 (2H), 4.52 (1H, m), 5.00 (2H, m), 6.80-7.30 (10H),  
7.60-7.84 (2H), 8.14 (1H, d, J=2Hz)

元素分析 : C<sub>30</sub>H<sub>32</sub>N<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S として

計算値 : C 69.74, H 6.24, N 5.42

実測値 : C 69.58, H 6.50, N 5.38

#### 実施例 15

2, 2-ジメチル-5-ジメチルアミノ-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-7-カルボン酸 1.40 g とクロロ炭酸エチル 0.78 ml、トリエチルアミン 1.7 ml、シス-3-アミノ-2-ベンズヒドリルキヌクリジン 1.61 g を用いて実施例 1 と同じ製造法に付することにより、シス-N-〔3-(2-ベンズヒドリルキヌクリジニル)〕-2, 2-ジメチル-5-ジメチルアミノ-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-7-カルボキサミド 1.15 g を得る。融点 234~235℃

NMR (CDCl<sub>3</sub>, 100 MHz) :

1.66 (3H, s), 1.84 (3H, s), 1.40-2.10 (5H), 2.70-3.20 (4H),  
2.84 (6H, s), 3.76-4.56 (3H), 6.75 (2H, d, J=2Hz),  
6.90-7.32 (11H), 8.24 (1H, d, J=10Hz)

元素分析 : C<sub>33</sub>H<sub>39</sub>N<sub>3</sub>O<sub>2</sub> として

計算値 : C 77.77, H 7.71, N 8.24

実測値 : C 77.96, H 7.87, N 8.15

#### 実施例 16

シス-N-〔3-(2-ベンズヒドリルキヌクリジニル)〕-6-クロロ-2, 2-ジメチル-3, 4-ジヒドロ-4-メチル-2H-1, 4-ベンズオキサジノン-8-カルボキサミド 3.0 g と 1 モル濃度のボランのテトラヒドロフラン溶液 30 ml を実施例 5 と同様の製造法に付することにより、シス-3-〔(6-クロロ-3, 4-ジヒドロ-2, 2-ジメチル-4-メチル-2H-1, 4-ベン

ズオキサジン-8-イル) メチル) アミノ-2-ベンズヒドリルキヌクリジン 1.6 gを得る。融点 166~167°C

NMR (CDCl<sub>3</sub>, 100 MHz) :

1.21 (3H, s), 1.24 (3H, s), 1.04-2.12 (8H), 2.44-2.90 (5H),  
2.87 (3H, s), 3.00-3.40 (2H), 3.68 (1H, m), 4.46 (1H, d, J=12Hz),  
5.74 (1H, d, J=3Hz), 6.43 (1H, d, J=3Hz), 7.00-7.40 (10H)

元素分析: C<sub>32</sub>H<sub>38</sub>ClN<sub>3</sub>Oとして

計算値: C 74.47, H 7.42, N 8.14

実測値: C 74.86, H 7.47, N 8.16

#### 実施例 17

シス-N-(3-(2-ベンズヒドリルキヌクリジニル))-5-メチルチオ-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-7-カルボキサミド 1.0 gと1モル濃度のボランのテトラヒドロフラン溶液 20 mlを実施例5と同様の製造法に付すことにより、シス-3-[(5-メチルチオ-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-7-イル) メチル] アミノ-2-ベンズヒドリルキヌクリジン 0.55 gを得る。融点 150~151°C

NMR (CDCl<sub>3</sub>, 100 MHz) :

1.10-2.10 (5H), 2.40 (3H, s), 2.45-3.30 (8H), 3.30-3.80 (2H),  
4.20-4.55 (3H), 6.44 (1H, d, J=2Hz), 6.90-7.38 (11H)

元素分析: C<sub>30</sub>H<sub>34</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>Sとして

計算値: C 76.56, H 7.28, N 5.95

実測値: C 76.27, H 7.29, N 5.91

#### 実施例 18

シス-N-(3-(2-ベンズヒドリルキヌクリジニル))-5-ベンジルチオ-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-7-カルボキサミド 0.78 gと1モル濃度のボランのテトラヒドロフラン溶液 15 mlを実施例5と同様の製造法に付すことにより、シス-3-[(5-ベンジルチオ-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-7-イル) メチル] アミノ-2-ベンズヒドリルキヌクリジン 0.51 gを得

る。

NMR (CDCl<sub>3</sub>, 100 MHz) :

1.04-2.10 (5H), 2.40-3.08 (6H), 3.16 (1H, s), 3.28-3.80 (2H),  
3.94 (1H, s), 4.28 (2H, t, J=8Hz), 4.46 (1H, d, J=12Hz),  
6.49 (1H, d, J=2Hz), 6.96 (1H, d, J=2Hz), 7.00-7.12 (15H)

#### 実施例 19

シス-N-〔3-(2-ベンズヒドリルキヌクリジニル)〕-5-イソプロピルチオ-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-7-カルボキサミド 0.82 g と 1 モル濃度のボランのテトラヒドロフラン溶液 16 ml を実施例 5 と同様の製造法に付すことにより、シス-3-〔(5-イソプロピルチオ-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-7-イル)メチル〕アミノ-2-ベンズヒドリルキヌクリジン 0.36 g を得る。融点 175~176°C

NMR (CDCl<sub>3</sub>, 100 MHz) :

1.21 (6H, d, J=7Hz), 1.30-2.10 (6H), 2.40-3.30 (9H),  
3.30-3.80 (2H), 4.20-4.56 (3H), 6.62 (1H, d, J=2Hz),  
6.90-8.38 (11H)

元素分析 : C<sub>32</sub>H<sub>33</sub>N<sub>2</sub>O<sub>5</sub> として

計算値 : C 77.07, H 7.68, N 5.62

実測値 : C 77.08, H 7.73, N 5.56

#### 実施例 20

シス-N-〔3-(2-ベンズヒドリルキヌクリジニル)〕-2, 2-ジメチル-5-メタンスルホニル-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-7-カルボキサミド 1.48 g と 1 モル濃度のボランのテトラヒドロフラン溶液 30 ml を実施例 5 と同様の製造法に付すことにより、シス-3-〔(2, 2-ジメチル-5-メタンスルホニル-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-7-イル)メチル〕アミノ-2-ベンズヒドリルキヌクリジン 0.54 g を得る。融点 162~164°C

NMR (CDCl<sub>3</sub>, 100 MHz) :

1.44 (6H, d, J=4Hz), 1.00-2.08 (6H), 2.40-3.40 (9H), 3.00 (3H, m),

3.70 (1H, m), 4.48 (1H, d, J=12Hz), 7.00-7.60 (12H)

元素分析:  $C_{32}H_{38}N_2O_3S$ として

計算値: C 72.42, H 7.22, N 5.28

実測値: C 72.45, H 7.31, N 5.19

#### 実施例 2 1

シス-N-〔3-(2-ベンズヒドリルキヌクリジニル)〕-5-メタンスルホニル-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-7-カルボキサミド 1.54 g と 1 モル濃度のボランのテトラヒドロフラン溶液 30 ml を実施例 5 と同様の製造法に付すことにより、シス-3-〔(5-メタンスルホニル-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-7-イル)メチル〕アミノ-2-ベンズヒドリルキヌクリジン 0.12 g を得る。融点 194~196°C

NMR (CDCl<sub>3</sub>, 100 MHz):

1.00-2.08 (6H), 2.40-3.28 (8H), 3.00 (3H, m), 3.49 (1H, m),

3.68 (1H, m), 4.30-4.60 (3H), 7.00-7.60 (12H)

元素分析:  $C_{32}H_{34}N_2O_3S$ として

計算値: C 71.69, H 6.82, N 5.57

実測値: C 71.70, H 6.84, N 5.53

#### 実施例 2 2

シス-N-〔3-(2-ベンズヒドリルキヌクリジニル)〕-2, 2-ジメチル-5-ジメチルアミノ-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-7-カルボキサミド 1.02 g と 1 モル濃度のボランのテトラヒドロフラン溶液 30 ml を実施例 5 と同様の製造法に付すことにより、シス-3-〔(2, 2-ジメチル-5-ジメチルアミノ-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-7-イル)メチル〕アミノ-2-ベンズヒドリルキヌクリジン 0.50 g を得る。融点 147~148°C

NMR (CDCl<sub>3</sub>, 100 MHz):

1.30 (6H, d, J=4Hz), 1.00-2.08 (6H), 2.40-3.40 (9H), 2.68 (6H, s),

3.00 (3H, m), 3.70 (1H, m), 4.48 (1H, d, J=12Hz), 5.85 (1H, m),

6.46 (1H, m), 6.90-7.50 (10H)

元素分析：C<sub>33</sub>H<sub>41</sub>N<sub>3</sub>O<sub>5</sub>Sとして

計算値：C 79.96, H 8.34, N 8.48

実測値：C 79.65, H 8.34, N 8.43

### 実施例 2 3

5-アセトアミド-2, 2-ジメチル-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-7-カルボン酸メチルエステル 2.4 gをエタノール 30 mlとテトラヒドロフラン 20 mlの混合溶媒に溶解させる。続いて臭化リチウム 1水和物 2.09 gと水素化ホウ素ナトリウム 0.76 gを加え、6時間還流させる。次に溶媒を濃縮除去し残渣を酢酸エチルと水に分配させ、酢酸エチル層を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液と飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥させる。硫酸マグネシウムと溶媒を除去し残渣をシリカゲルクロマトにより精製して、5-アセトアミド-2, 2-ジメチル-7-ヒドロキシメチル-2, 3-ジヒドロベンゾフラン 1.5 gを得る。かくして得られる5-アセトアミド-2, 2-ジメチル-7-ヒドロキシメチル-2, 3-ジヒドロベンゾフラン 1.5 gをジクロロエタン 25 mlに溶解させ氷冷下、塩化チオニル 0.6 mlを加え2時間攪拌する。次に反応液を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液と飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥させる。硫酸マグネシウムと溶媒を除去し残渣にノルマルヘキサンを加えて結晶化させることにより、5-アセトアミド-7-クロロメチル-2, 2-ジメチル-2, 3-ジヒドロベンゾフラン 1.45 gを得る。融点 164~165℃

5-アセトアミド-7-クロロメチル-2, 2-ジメチル-2, 3-ジヒドロベンゾフラン 0.51 g、シス-3-アミノ-2-ベンズヒドリルキヌクリジン 0.59 gをジメチルホルムアミド 10 mlに溶解させ、炭酸カリウム 0.55 gを加えて一昼夜室温にて攪拌する。反応液を水とクロロホルムに分配させ、クロロホルム層を濃縮後シリカゲルカラムクロマトにて精製することにより、シス-3-[(5-アセトアミド-2, 2-ジメチル-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-7-イル)メチル]アミノ-2-ベンズヒドリルキヌクリジン 0.23 gを得る。

### 実施例 2 4

バイオオーガニック・アンド・メディシナル・ケミストリー・レターズ(Bio-organic & Medicinal Chemistry Letters) Vol.1, No.2, pp 129-132に記載の方法にて合成される(－)－3－アミノ－2－ベンズヒドリルキヌクリジン30mgと5－メチルチオ－2, 3－ジヒドロベンゾフラン－7－カルボン酸32mg、トリエチルアミン0.042ml、クロロ炭酸エチル0.016mlを用いて実施例1と同様の製造法に付することにより、(－)－シス－N－〔3－(2－ベンズヒドリルキヌクリジニル)〕－5－メチルチオ－2, 3－ジヒドロベンゾフラン－7－カルボキサミド40mgを得る。かくして得られるアミド体を1モル濃度のボランのテトラヒドロフラン溶液3mlを用いて実施例5と同じ製造法に付し、シリカゲルクロマトグラフィーにて精製することにより、(－)－シス－3－〔(5－メチルチオ－2, 3－ジヒドロベンゾフラン－7－イル)メチル〕アミノ－2－ベンズヒドリルキヌクリジン4mgを得る。

#### 製剤例

次に、本発明の医薬の製剤例をあげる。

##### (1) 錠剤

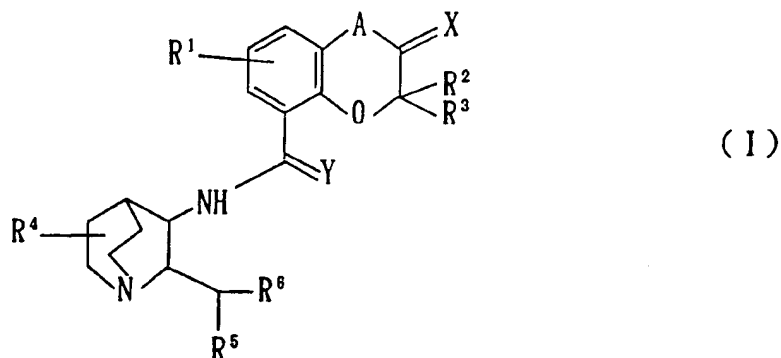
上記化合物(I)を0.5部、乳糖25部、結晶セルロース35部およびコーンスターチ3部とをよく混和したのち、コーンスターチ2部で製した結合剤とよく練合する。この練合物を16メッシュで篩過し、オープン中50℃で乾燥後、24メッシュで篩過する。ここに得た練合粉体とコーンスターチ8部、結晶セルロース11部およびタルク9部とをよく混合した後、圧搾打錠し、1錠当たり有効成分0.5mg含有の錠剤を得る。

##### (2) 1%散剤

上記の化合物(I)を1部と乳糖90部をよく混和し、適当量のメチルセルロースより製した結合剤とよく練合する。これを16メッシュで篩過し、オープン中50℃で乾燥する。乾燥顆粒末を32メッシュで圧篩過し、適量のシリコンジオキシドとよく混和して、1%散剤を得る。

## 請求の範囲

## 1. 一般式 (I) :



〔式中、Aはメチレン基、酸素原子、硫黄原子、 $-N(R^7)-$ で表される基（式中、 $R^7$ は水素、炭素数1～6個のアルキルまたはアラルキルを示す。）または直接結合を示す。XおよびYは同一または異なって酸素原子、硫黄原子または水素2原子を示す。 $R^1$ は水素、ハロゲン、炭素数1～6個のアルキル、ハロアルキル、アラルキル、炭素数1～6個のアルコキシ、アラルキルオキシ、アリールオキシ、アシル、アシルオキシ、ヒドロキシ、アミノ、ニトロ、シアノまたは式  
 $-NHCOR^8$ ,  $-S(O)_nR^8$ ,  $-NH SO_2R^8$ ,  $-COOR^8$ ,  
 $-N(R^8)(R^8)$ ,  $-CON(R^8)(R^8)$ ,  $-O-CO-N(R^8)(R^8)$ ,  
 $-O-CS-N(R^8)(R^8)$ ,  $-SO_2N(R^8)(R^8)$

（式中、 $R^8$ ,  $R^8$ は同一または異なってそれぞれ水素、炭素数1～6個のアルキル、フェニルまたはアラルキルを示し、nは0, 1または2を示す。）から選ばれる基を示す。 $R^2$ ,  $R^3$ は同一または異なって水素または炭素数1～6個のアルキルを示す。 $R^4$ は水素または炭素数1～6個のアルキルを示す。 $R^5$ はチエニルまたはフェニルを示す。 $R^6$ は炭素数1～6個のアルキル、炭素数2～6個のアルケニル、炭素数3～7個のシクロアルキル、フリル、チエニル、ピリジル、インドリル、ビフェニルまたはフェニルを示す。ただし、Aが酸素原子、かつXおよびYが共に水素2原子、かつ $R^1$ が水素、かつ $R^2$ ,  $R^3$ が共に水素である場合、およびAが直接結合、かつXおよびYが共に水素2原子、かつ $R^1$



が水素、かつ $R^2$ ,  $R^3$  が共に水素である場合を除く。]

により表されるキヌクリジン化合物またはその医薬上許容されうる酸付加塩。

2. Aが $-N(CH_3)-$ または直接結合を示し、XおよびYが同一または異なって酸素原子または水素2原子を示し、 $R^2$ ,  $R^3$  が共に水素または共にメチルを示し、 $R^4$  が水素を示し、 $R^5$ ,  $R^6$  が共にフェニルであることを特徴とする請求の範囲第1項記載のキヌクリジン化合物またはその医薬上許容されうる酸付加塩。ただし、Aが直接結合、かつXおよびYが共に水素2原子、かつ $R^1$  が水素、かつ $R^2$ ,  $R^3$  が共に水素である場合を除く。

3. シス-N-[3-(2-ベンズヒドリルキヌクリジニル)]-6-クロロ-3, 4-ジヒドロ-4-メチル-2H-1, 4-ベンズオキサジン-8-カルボキサミド、シス-N-[3-(2-ベンズヒドリルキヌクリジニル)]-2, 2-ジメチル-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-7-カルボキサミド、シス-N-[3-(2-ベンズヒドリルキヌクリジニル)]-2, 2-ジメチル-5-メチルチオ-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-7-カルボキサミド、シス-N-[3-(2-ベンズヒドリルキヌクリジニル)]-2, 2-ジメチル-5-ニトロ-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-7-カルボキサミド、シス-3-[(2, 2-ジメチル-5-ニトロ-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-7-イル)メチル]アミノ-2-ベンズヒドリルキヌクリジン、シス-3-[(2, 2-ジメチル-5-メチルチオ-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-7-イル)メチル]アミノ-2-ベンズヒドリルキヌクリジン、シス-3-[(2, 2-ジメチル-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-7-イル)メチル]アミノ-2-ベンズヒドリルキヌクリジン、シス-3-[(6-クロロ-3, 4-ジヒドロ-4-メチル-2H-1, 4-ベンズオキサジン-8-イル)メチル]アミノ-2-ベンズヒドリルキヌクリジン、シス-N-[3-(2-ベンズヒドリルキヌクリジニル)]-6-クロロ-2, 2-ジメチル-3, 4-ジヒドロ-4-メチル-2H-1, 4-ベンズオキサジン-8-カルボキサミド、シス-N-[3-(2-ベンズヒドリルキヌクリジニル)]-5-メチルチオ-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-7-カルボキサミド、シス-N-[3-(2-ベンズヒドリルキヌクリジニル)]-5-ベ

ンジルチオ-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-7-カルボキサミド、シス-N-[3-(2-ベンズヒドリルキヌクリジン)]-5-イソプロピルチオ-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-7-カルボキサミド、シス-N-[3-(2-ベンズヒドリルキヌクリジン)]-2, 2-ジメチル-5-メタンスルホニル-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-7-カルボキサミド、シス-N-[3-(2-ベンズヒドリルキヌクリジン)]-5-メタンスルホニル-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-7-カルボキサミド、シス-N-[3-(2-ベンズヒドリルキヌクリジン)]-2, 2-ジメチル-5-ジメチルアミノ-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-7-カルボキサミド、シス-3-[(6-クロロ-3, 4-ジヒドロ-2, 2-ジメチル-4-メチル-2H-1, 4-ベンズオキサジン-8-イル)メチル]アミノ-2-ベンズヒドリルキヌクリジン、シス-3-[(5-メチルチオ-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-7-イル)メチル]アミノ-2-ベンズヒドリルキヌクリジン、シス-3-[(5-ベンジルチオ-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-7-イル)メチル]アミノ-2-ベンズヒドリルキヌクリジン、シス-3-[(5-イソプロピルチオ-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-7-イル)メチル]アミノ-2-ベンズヒドリルキヌクリジン、シス-3-[(2, 2-ジメチル-5-メタンスルホニル-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-7-イル)メチル]アミノ-2-ベンズヒドリルキヌクリジン、シス-3-[(5-メタンスルホニル-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-7-イル)メチル]アミノ-2-ベンズヒドリルキヌクリジン、シス-3-[(2, 2-ジメチル-5-ジメチルアミノ-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-7-イル)メチル]アミノ-2-ベンズヒドリルキヌクリジン、シス-3-[(5-アセトアミド-2, 2-ジメチル-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-7-イル)メチル]アミノ-2-ベンズヒドリルキヌクリジン、および(-)-シス-3-[(5-メチルチオ-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-7-イル)メチル]アミノ-2-ベンズヒドリルキヌクリジンから選ばれる請求の範囲第1項または第2項記載のキヌクリジン化合物またはその医薬上許容されうる酸付加塩。

4. 請求の範囲第1項ないし第3項のいずれかに記載の化合物の治療上有効量と、

医薬上許容されうる添加剤からなる医薬組成物。

5. 請求の範囲第1項ないし第3項のいずれかに記載の化合物を有効成分として含有することを特徴とする鎮痛抗炎症薬。

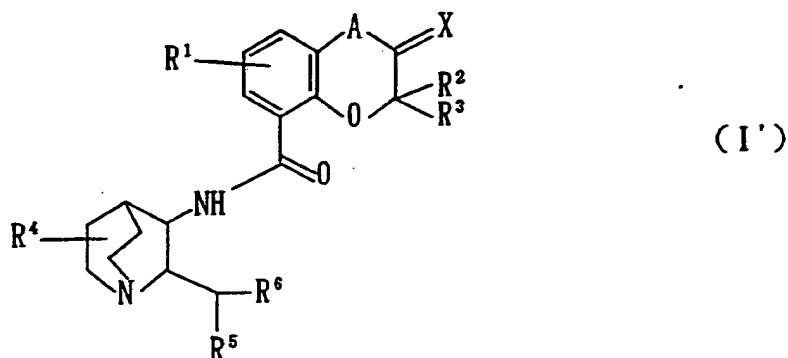
6. 請求の範囲第1項ないし第3項のいずれかに記載の化合物を有効成分として含有することを特徴とする咳、喀痰を伴う慢性気管支炎、喘息、鼻炎などの呼吸器系疾患の治療薬。

7. 請求の範囲第1項ないし第3項のいずれかに記載の化合物を有効成分として含有することを特徴とする不安症、精神病などの中枢神経系疾患の治療薬。

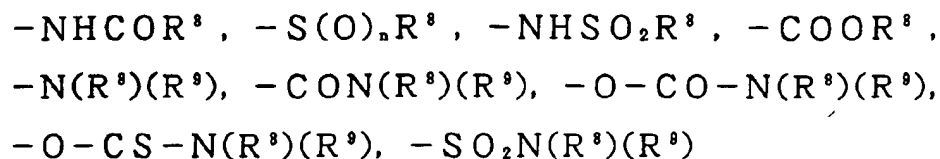
8. 請求の範囲第1項ないし第3項のいずれかに記載の化合物を有効成分として含有することを特徴とする高血圧症、心不全などの循環器系疾患の治療薬。

9. 請求の範囲第1項ないし第3項のいずれかに記載の化合物を有効成分として含有することを特徴とする過敏性大腸炎、潰瘍性大腸炎、クローン病などの消化器系疾患の治療薬。

10. 一般式 (I'):



〔式中、Aはメチレン基、酸素原子、硫黄原子、 $-N(R^7)-$ で表される基（式中、 $R^7$ は水素、炭素数1～6個のアルキルまたはアラルキルを示す。）または直接結合を示す。Xは酸素原子、硫黄原子または水素2原子を示す。 $R^1$ は水素、ハロゲン、炭素数1～6個のアルキル、ハロアルキル、アラルキル、炭素数1～6個のアルコキシ、アラルキルオキシ、アリアルオキシ、アシル、アシルオキシ、ヒドロキシ、アミノ、ニトロ、シアノまたは式



(式中、 $\text{R}^8$ 、 $\text{R}^9$ は同一または異なってそれぞれ水素、炭素数1～6個のアルキル、フェニルまたはアラルキルを示し、 $n$ は0、1または2を示す。)

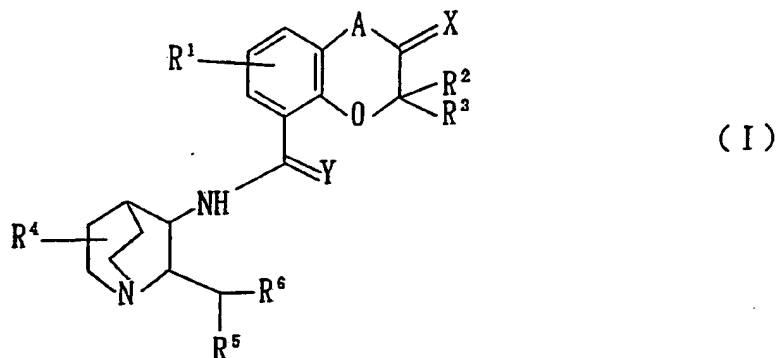
から選ばれる基を示す。 $\text{R}^2$ 、 $\text{R}^3$ は同一または異なって水素または炭素数1～6個のアルキルを示す。 $\text{R}^4$ は水素または炭素数1～6個のアルキルを示す。 $\text{R}^5$ はチエニルまたはフェニルを示す。 $\text{R}^6$ は炭素数1～6個のアルキル、炭素数2～6個のアルケニル、炭素数3～7個のシクロアルキル、フリル、チエニル、ピリジル、インドリル、ビフェニルまたはフェニルを示す。]

により表されるキヌクリジン化合物またはその医薬上許容されうる酸付加塩。

## 補正された請求の範囲

[1993年4月5日(05.04.93) 国際事務局受理; 出願当初の請求の範囲1,2 及び10は補正された; 他の請求の範囲は変更なし。(5頁)]

## 1. (補正後) 一般式 (I) :



(式中、Aはメチレン基、酸素原子、硫黄原子、 $-N(R^7)-$ で表される基(式中、 $R^7$ は水素、炭素数1~6個のアルキルまたはアラルキルを示す。)または直接結合を示す。XおよびYは同一または異なって酸素原子、硫黄原子または水素2原子を示す。 $R^1$ は水素、ハロゲン、炭素数1~6個のアルキル、ハロアルキル、アラルキル、炭素数1~6個のアルコキシ、アラルキルオキシ、アリアルコキシ、アシル、アシルオキシ、ヒドロキシ、アミノ、ニトロ、シアノまたは式

$-NHCOR^8$ ,  $-S(O)_nR^8$ ,  $-NH SO_2R^8$ ,  $-COOR^8$ ,

$-N(R^8)(R^9)$ ,  $-CON(R^8)(R^9)$ ,  $-O-CO-N(R^8)(R^9)$ ,

$-O-CS-N(R^8)(R^9)$ ,  $-SO_2N(R^8)(R^9)$ )

(式中、 $R^8$ ,  $R^9$ は同一または異なってそれぞれ水素、炭素数1~6個のアルキル、フェニルまたはアラルキルを示し、nは0, 1または2を示す。)

から選ばれる基を示す。 $R^2$ ,  $R^3$ は同一または異なって水素または炭素数1~6個のアルキルを示す。 $R^4$ は水素または炭素数1~6個のアルキルを示す。 $R^5$ はチエニルまたはフェニルを示す。 $R^6$ は炭素数1~6個のアルキル、炭素数2~6個のアルケニル、炭素数3~7個のシクロアルキル、フリル、チエニル、ピリジル、インドリル、ビフェニルまたはフェニルを示す。ただし、Aが酸素原子、かつXが水素2原子、Yが酸素原子または水素2原子、かつ $R^1$ が水素、かつ $R^2$ ,  $R^3$ が共に水素である場合、およびAが直接結合、かつXが水素2原子、Yが酸

素原子または水素 2 原子、かつ  $R^1$  が水素、かつ  $R^2$ ,  $R^3$  が共に水素である場合を除く。]

により表されるキヌクリジン化合物またはその医薬上許容されうる酸付加塩。

2. (補正後) A が  $-N(CH_3)-$  または直接結合を示し、X および Y が同一または異なって酸素原子または水素 2 原子を示し、 $R^2$ ,  $R^3$  が共に水素または共にメチルを示し、 $R^4$  が水素を示し、 $R^5$ ,  $R^6$  が共にフェニルであることを特徴とする請求の範囲第 1 項記載のキヌクリジン化合物またはその医薬上許容されうる酸付加塩。ただし、A が直接結合、かつ X が水素 2 原子、Y が酸素原子または水素 2 原子、かつ  $R^1$  が水素、かつ  $R^2$ ,  $R^3$  が共に水素である場合を除く。

3. シス-N-〔3-(2-ベンズヒドリルキヌクリジニル)〕-6-クロロ-3, 4-ジヒドロ-4-メチル-2H-1, 4-ベンズオキサジン-8-カルボキサミド、シス-N-〔3-(2-ベンズヒドリルキヌクリジニル)〕-2, 2-ジメチル-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-7-カルボキサミド、シス-N-〔3-(2-ベンズヒドリルキヌクリジニル)〕-2, 2-ジメチル-5-メチルチオ-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-7-カルボキサミド、シス-N-〔3-(2-ベンズヒドリルキヌクリジニル)〕-2, 2-ジメチル-5-ニトロ-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-7-カルボキサミド、シス-3-〔(2, 2-ジメチル-5-ニトロ-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-7-イル)メチル〕アミノ-2-ベンズヒドリルキヌクリジン、シス-3-〔(2, 2-ジメチル-5-メチルチオ-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-7-イル)メチル〕アミノ-2-ベンズヒドリルキヌクリジン、シス-3-〔(2, 2-ジメチル-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-7-イル)メチル〕アミノ-2-ベンズヒドリルキヌクリジン、シス-3-〔(6-クロロ-3, 4-ジヒドロ-4-メチル-2H-1, 4-ベンズオキサジン-8-イル)メチル〕アミノ-2-ベンズヒドリルキヌクリジン、シス-N-〔3-(2-ベンズヒドリルキヌクリジニル)〕-6-クロロ-2, 2-ジメチル-3, 4-ジヒドロ-4-メチル-2H-1, 4-ベンズオキサジン-8-カルボキサミド、シス-N-〔3-(2-ベンズヒドリルキヌクリジニル)〕-5-メチルチオ-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-7-カルボ

キサミド、シス-N-[3-(2-ベンズヒドリルキヌクリジニル)]-5-ベ

医薬上許容されうる添加剤からなる医薬組成物。

5. 請求の範囲第1項ないし第3項のいずれかに記載の化合物を有効成分として含有することを特徴とする鎮痛抗炎症薬。

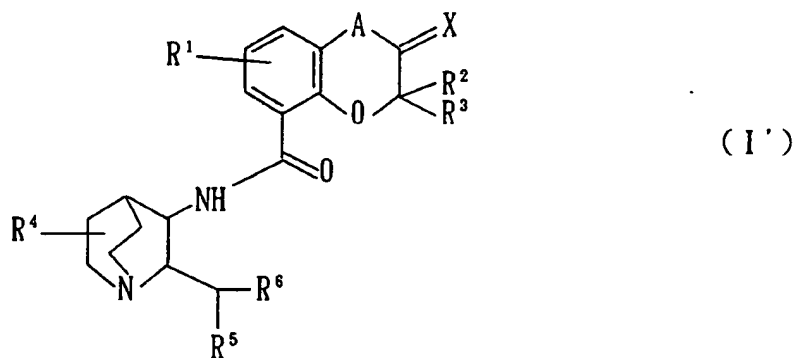
6. 請求の範囲第1項ないし第3項のいずれかに記載の化合物を有効成分として含有することを特徴とする咳、喀痰を伴う慢性気管支炎、喘息、鼻炎などの呼吸器系疾患の治療薬。

7. 請求の範囲第1項ないし第3項のいずれかに記載の化合物を有効成分として含有することを特徴とする不安症、精神病などの中枢神経系疾患の治療薬。

8. 請求の範囲第1項ないし第3項のいずれかに記載の化合物を有効成分として含有することを特徴とする高血圧症、心不全などの循環器系疾患の治療薬。

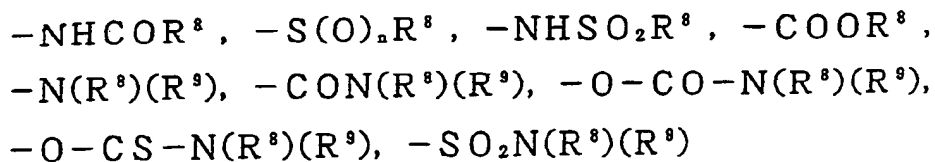
9. 請求の範囲第1項ないし第3項のいずれかに記載の化合物を有効成分として含有することを特徴とする過敏性大腸炎、潰瘍性大腸炎、クローン病などの消化器系疾患の治療薬。

10. (補正後) 一般式 (I'):



〔式中、Aはメチレン基、酸素原子、硫黄原子、 $-N(R^7)-$ で表される基（式中、 $R^7$ は水素、炭素数1～6個のアルキルまたはアラルキルを示す。）または直接結合を示す。Xは酸素原子、硫黄原子または水素2原子を示す。 $R^1$ は水素、ハロゲン、炭素数1～6個のアルキル、ハロアルキル、アラルキル、炭素数1～6個のアルコキシ、アラルキルオキシ、アリアルオキシ、アシル、アシルオキシ、ヒドロキシ、アミノ、ニトロ、シアノまたは式





(式中、 $\text{R}^8$ 、 $\text{R}^9$ は同一または異なってそれぞれ水素、炭素数1～6個のアルキル、フェニルまたはアラルキルを示し、 $n$ は0、1または2を示す。) から選ばれる基を示す。 $\text{R}^2$ 、 $\text{R}^3$ は同一または異なって水素または炭素数1～6個のアルキルを示す。 $\text{R}^4$ は水素または炭素数1～6個のアルキルを示す。 $\text{R}^5$ はチエニルまたはフェニルを示す。 $\text{R}^6$ は炭素数1～6個のアルキル、炭素数2～6個のアルケニル、炭素数3～7個のシクロアルキル、フリル、チエニル、ピリジル、インドリル、ビフェニルまたはフェニルを示す。ただし、 $A$ が酸素原子、かつ $X$ が水素2原子、かつ $\text{R}^1$ が水素、かつ $\text{R}^2$ 、 $\text{R}^3$ が共に水素2原子である場合、および $A$ が直接結合、かつ $X$ が水素2原子、かつ $\text{R}^1$ が水素、かつ $\text{R}^2$ 、 $\text{R}^3$ が共に水素2原子である場合を除く。]

により表されるキヌクリジン化合物またはその医薬上許容されうる酸付加塩。

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP92/01426

## A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

Int. Cl<sup>5</sup> C07D453/02, A61K31/435, 31/44, 31/535

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

## B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

Int. Cl<sup>5</sup> C07D453/02, A61K31/435-31/44, 31/535

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)

CAS ONLINE

## C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

| Category* | Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages  | Relevant to claim No. |
|-----------|---|-----------------------|
| X<br>Y    | JP, A, 3-503768 (Pfizer Inc.),<br>August 22, 1991 (22. 08. 91),<br>Claim & WO, A1, 90/05525<br>& EP, A, 409931 & US, A, 5162339 | 10<br>1-9             |

☐ Further documents are listed in the continuation of Box C.

☐ See patent family annex.

\* Special categories of cited documents:

"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance

"E" earlier document but published on or after the international filing date

"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)

"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means

"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art

"&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

January 14, 1993 (14. 01. 93)

Date of mailing of the international search report

February 9, 1993 (09. 02. 93)

Name and mailing address of the ISA/

Japanese Patent Office

Facsimile No.

Authorized officer

Telephone No.

|  |  |                  |
|--|--|------------------|
| A. 発明の属する分野の分類 (国際特許分類 (IPC))<br>Int. Cl. <sup>3</sup><br>C 07 D 4 5 3 / 0 2 , A 6 1 K 3 1 / 4 3 5 , 3 1 / 4 4 , 3 1 / 5 3 5   |  |                  |
| B. 調査を行った分野<br>調査を行った最小限資料 (国際特許分類 (IPC))<br>Int. Cl. <sup>3</sup><br>C 0 7 D 4 5 3 / 0 2 , A 6 1 K 3 1 / 4 3 5 - 3 1 / 4 4 , 3 1 / 5 3 5<br>最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの  |  |                  |
| 国際調査で使用了電子データベース (データベースの名称、調査に使用した用語)<br>CAS ONLINE   |  |                  |
| C. 関連すると認められる文献  |  |                  |
| 引用文献の<br>カテゴリー*  | 引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示  | 関連する<br>請求の範囲の番号 |
| X<br>Y   | JP, A, 3-503768 (Pfizer Inc.)<br>22. 8月. 1991 (22. 08. 91) ,<br>特許請求の範囲 & WO, A1, 90/05525<br>& EP, A, 409931 & US, A, 5162339 | 1 0<br>1 - 9     |
| <input type="checkbox"/> C欄の続きにも文献が列挙されている。 <input type="checkbox"/> パテントファミリーに関する別紙を参照。   |  |                  |
| * 引用文献のカテゴリー<br>「A」 特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの<br>「E」 先行文献ではあるが、国際出願日以後に公表されたもの<br>「L」 優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献 (理由を付す)<br>「O」 口頭による開示、使用、展示等に言及する文献<br>「P」 国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願の日の後に公表された文献<br>「T」 国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの<br>「X」 特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの<br>「Y」 特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの<br>「&」 同一パテントファミリー文献 |  |                  |
| 国際調査を完了した日<br>14. 01. 93   | 国際調査報告の発送日<br>09.02.93   |                  |
| 名称及びあて先<br>日本国特許庁 (ISA/JP)<br>郵便番号100<br>東京都千代田区霞が関三丁目4番3号   | 特許庁審査官 (権限のある職員)<br>大 宅 郁 治  | 4 C 8 8 2 9      |
| 電話番号 03-3581-1101 内線   |  | 3452             |